

OLARTEMOURE

OLARTE MOURE & ASOCIADOS LTDA.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-165101- -00015-0000

Fecha: 2014-05-15 16:33:19 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 412 REOSPPRESRECU Folios: 16

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

Carlos R. Olarte
Juan G. Mourc

Alexander Agudelo
Carlos A. Parra
Juan F. Acosta
Andrés Rincón
Mónica Guevara
Andrés Alvarado
María C. Calderón
Mauricio Ávila
José J. Dangond
Gina Cáceres
Isabella Herrera
ZaavaRavid
Alejandro Mourc
Miguel F. Pórras
Catalina Amaya
Laura M. Escobar
Lorena Andrade
Sergio Arboleda
Carolina Celis
Catalina Jiménez

Medellín
María C. Múnera
Eddie Manotas
Adrián Santamaría

Barranquilla
Gina de Echcona

Re: Expediente N° 11-165.101

Solicitud de Patente de Invención titulada: “DERIVADOS AMINO-PROPIÓNICOS SUSTITUIDOS COMO INHIBIDORES DE NEPRILISINA”

Solicitante: NOVARTIS AG

Nuestra Ref.: P2011/000208

RECURSO DE REPOSICIÓN

CARLOS R. OLARTE, mayor de edad y vecino de Bogotá, D.C., identificado como aparece al pie de mi firma, en mi condición de apoderado de la sociedad solicitante, y dentro del término legal previsto por el artículo 51 del Código Contencioso Administrativo, me dirijo a su Despacho con el fin de interponer RECURSO DE REPOSICIÓN para modificar y corregir los errores materiales en la versión impresa del Capítulo Reivindicatorio Modificado al que la Resolución No. 21348, notificada por edicto desfijado el 8 de mayo de 2014, le concedió el privilegio de patente de invención.

1. ANTECEDENTES

1.1. Mediante solicitud radicada ante la Superintendencia de Industria y Comercio (SIC) el 30 de noviembre de 2011, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada “DERIVADOS AMINO-PROPIÓNICOS SUSTITUIDOS COMO INHIBIDORES DE NEPRILISINA” estudiada bajo el expediente 11-165.101, que corresponde a la solicitud internacional PCT/EP2010/057247 del 26 de mayo de 2010.

1.2. La solicitud de la referencia fue publicada en la Gaceta de Propiedad Industrial No. 647 del 29 de junio de 2012. No se presentaron oposiciones.

1.3. Mediante Oficio No. 19885, notificado por fijación en lista del 29 de octubre de 2013, y como resultado del examen de fondo, la SIC solicitó se presentara respuesta a las observaciones de carácter técnico relacionadas con el cumplimiento de los requisitos establecidos por la Decisión 486 para la concesión de la patente.

1.4. En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486, mediante escrito radicado el 7 de marzo de 2014, respondí oportunamente el requerimiento formulado por la SIC y presenté un Capítulo Reivindicatorio Modificado, el cual reemplazó el originalmente presentado, atendiendo de esta manera las observaciones efectuadas por el Examinador.

1.5. El 31 de marzo de 2014 a través de la Resolución No. 21348, la SIC decidió conceder el privilegio de patente a la solicitud de la referencia.

1.6. Al revisar la versión impresa del Capítulo Reivindicatorio Modificado presentado junto con mi respuesta al primer examen de fondo el 7 de marzo 2014, y al que se refiere la concesión de la Resolución No. 21348, nos percatamos que:

- por un error involuntario de impresión la parte de debajo de la primera página del Capítulo Reivindicatorio Modificado está incompleta, ya que hace falta: el número de átomos del alquilodel grupo $C(O)N(\text{alquilo } C_{1-6})_2$, la definición del radical B^1 , y dos definiciones del radical A^1 ;
- una de las definiciones del radical R^4 en la Reivindicación 3 (página 4) del Capítulo Reivindicatorio Modificado era es arilo C_{6-20} , lo cual está por fuera del alcance de la Reivindicación 1, que define tal radical como un grupo es arilo C_{6-10} .

2. OBJETO DEL RECURSO

El objeto de este recurso es que se acepte la modificación de la Reivindicación 3 y la corrección de los errores materiales en la versión impresa del Capítulo Reivindicatorio Modificado al que la Resolución No. 21348 concedió el privilegio de patente de invención.

3. FUNDAMENTO DEL RECURSO

3.1. Esta solicitud encuentra fundamento en el artículo 34 de la normatividad andina (Decisión 486), entendiéndose que hasta que la Resolución que da por terminado el trámite administrativo no se encuentre en firme, el Solicitante está autorizado para hacer uso de la prerrogativa consignada en él; el cual establece que:

“Artículo 34: El solicitante de una patente podrá pedir que se modifique la solicitud en cualquier momento del trámite. La modificación no podrá implicar una ampliación de la protección que correspondería a la divulgación contenida en la solicitud inicial.

Del mismo modo, se podrá pedir la corrección de cualquier error material”(Subrayado y negrilla fuera del texto).

El Tribunal de Justicia de la Comunidad Andina, en relación al mencionado artículo y de la oportunidad que éste le brinda al Solicitante ha reiterado que:

“Respecto de la norma analizada (artículo 34) no determina el tiempo o el plazo durante el cual el petionario puede modificar la solicitud. Como no se establece nada al respecto, y como de los principios en que se soporta la normativa sobre patentes no se desprende limitación temporal alguna sobre este tema, se debe interpretar dicha norma en el sentido de que el solicitante puede realizar las modificaciones en cualquier estado del trámite”¹. (Subrayado y negrilla fuera del texto)

Este Tribunal también se ha referido a la posibilidad de incluir la modificación al interponer el Recurso de Reposición posterior al acto administrativo que decide sobre la concesión o negación de la solicitud de patente, sobre el particular ha mencionado que:

“...la modificación a la solicitud de patente puede realizarse en cualquier estado del trámite, y dependerá de lo que disponga el Derecho interno de los Países Miembros la posibilidad de que tal reforma se efectúe incluso al interponer un recurso administrativo”.²

¹ Tribunal de Justicia de la Comunidad Andina, Proceso 38-IP-2012. Solicitud de Patente: “Unidad de control de salida para generador síncrono”.

² Tribunal de Justicia de la Comunidad Andina, Proceso 21-IP-2000. Solicitud de Patente: “Procedimientos para preparación de derivados de Sal de Bilis humana estimulada por lipasa y para la preparación de Composiciones Farmacéuticas que los contiene”.

De hecho, la única limitación que dicho artículo le impone al Solicitante respecto a una eventual modificación, consiste en que ésta no debe implicar una ampliación de la materia divulgada en la solicitud inicial. Con relación a esto, el Tribunal de Justicia de la Comunidad Andina ha establecido que:

*“...la modificación de la solicitud podrá concretar el invento o reducir el alcance de las reivindicaciones, sin importar cuál haya sido la redacción originariamente propuesta; por lo que aun cuando el cambio sea sustancial con relación a las reivindicaciones iniciales, lo único relevante viene a ser que las nuevas reivindicaciones puedan seguir siendo sustentadas racionalmente con fundamento en la descripción contenida en la solicitud inicial”.*³(Subrayado y negrilla fuera del texto)

3.2. De acuerdo con lo anterior, me permito presentar un **Capítulo Reivindicatorio Modificado** en el cual se modifica uno de los significados del radical R⁴ en la Reivindicación 3, y para corregir el error material en la impresión en la primera página del Capítulo Reivindicatorio concedido.

Resulta relevante señalar que ni la modificación en la definición del grupo “arilo” en el sustituyente R⁴ en la Reivindicación 3, ni la corrección a la primera página del Capítulo Reivindicatorio (inclusión de las líneas no impresas) implican una ampliación de la materia divulgada en la solicitud inicial, tal como lo establece el artículo 34 de la Decisión 486. Así como tampoco estas modificaciones y correcciones se ven afectadas por el arte previo citado y analizado en el trámite.

a- El radical R⁴ en la Reivindicación 1 del Capítulo Reivindicatorio Modificado radicado junto con mi respuesta al primer examen de fondo está definido como:

R⁴ es ariloC₆₋₁₀, o un heteroarilo, el cual puede ser monocíclico o bicíclico, y el cual puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir del grupo que consiste en hidroxilo, hidroxi-alquiloC₁₋₇, nitró, -NR^aR^b, -C(O)-alquiloC₁₋₇, C(O)-O-alquiloC₁₋₇, alcóxidoC₁₋₇, halógeno, alquiloC₁₋₇, alquenoC₂₋₇, ariloC₆₋₁₀, heteroarilo, -NHSO₂-alquiloC₁₋₇ y bencilo;

Es decir, una de las definiciones del radical R⁴ es un grupo arilo que contiene entre 6 y 10 átomos de carbono.

³ Tribunal de Justicia de la Comunidad Andina, Proceso 25-IP-2002. Solicitud de Patente: “Iminoderivados cíclicos”.

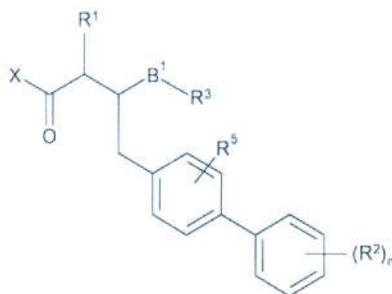
Sin embargo, por un error involuntario, la definición del mismo radical en la Reivindicación 3 (dependiente de la Reivindicación 1 anterior) del Capítulo Reivindicatorio Modificado radicado junto con mi respuesta al primer examen de fondo decía:

R^4 es arilo C_{6-20} o un heteroarilo, cada uno de los cuales puede ser monocíclico o bicíclico, y cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir del grupo que consiste en hidroxilo, alcoxilo C_{1-7} , halógeno, alquilo C_{1-7} , halo-alquilo C_{1-7} , arilo C_{6-10} , heteroarilo, -NHSO $_2$ -alquilo C_{1-7} y bencilo;

Es decir, una de las definiciones del radical R^4 es un grupo arilo que contiene entre 6 y 20 átomos de carbono.

Es evidente entonces que el alcance de dicha Reivindicación 3 era más amplio que el de la Reivindicación 1, por lo que en el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto al presente Recurso se corrige la definición del grupo arilo en la Reivindicación 3, y ahora es consistente con la definición del mismo grupo en la Reivindicación 1.

b- La presente invención reclama compuestos caracterizados por la siguiente fórmula estructural:



La Reivindicación 1 de las reivindicaciones presentadas al momento de radicar la solicitud de patente (30 de noviembre de 2011) contenía las siguientes definiciones:

X y X' son independientemente OH, -O-alquilo de 1 a 7 átomos de carbono, -NR^aR^b, -NHS(O)₂-alquilo de 1 a 7 átomos de carbono, -NHS(O)₂-bencilo u -O-arilo de 6 a 10 átomos de carbono; en donde el alquilo está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir del grupo que consiste en arilo de 6 a 10 átomos de carbono, heteroarilo, heterociclilo, C(O)NH₂, C(O)NH-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, y C(O)N(alquilo de 1 a 6 átomos de carbono)₂;

B¹ es -C(O)NH- o -NHC(O)-;

A¹ es un enlace o un alquileo de 1 a 7 átomos de carbono lineal o ramificado, que está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir del grupo que consiste en halógeno, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 7 átomos de carbono, hidroxilo, y O-acetato; en donde dos grupos alquilo geminales pueden combinarse opcionalmente para formar un cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono; o

A¹ es un alquienilo de 1 a 7 átomos de carbono lineal o ramificado; o

Por un error involuntario al momento de imprimir el Capítulo Reivindicatorio Modificado que se radicó junto con mi respuesta al primer examen de fondo, el número de átomos del alquilo en el grupo C(O)N(alquilo C₁₋₆)₂, la definición del radical B¹, y dos definiciones del radical A¹ no se imprimieron, como es evidente en la siguiente imagen tomada del Capítulo Reivindicatorio radicado que se encuentra en la base de datos de la Superintendencia de Industria y Comercio (SIC):

X y X' son independientemente OH, -O-alquiloC₁₋₇, -NR^aR^b, -NHS(O)₂-alquiloC₁₋₇, -NHS(O)₂-bencilo u -O-ariloC₆₋₁₀; en donde el alquilo está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir del grupo que consiste en ariloC₆₋₁₀, heteroarilo, heterociclilo, C(O)NH₂, C(O)NH-alquiloC₁₋₆, y C(O)N(alquilo

Expediente No. 11-165,101
Primer Examen de Fondo
P2011/000208

A¹ es un alquileo lineal C₁₋₇, en donde uno o más átomos de carbono es/son reemplazados con un heteroátomo seleccionado a partir de O, NR^c; y A¹ está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir del grupo que consiste en halógeno y alquiloC₁₋₇; en donde R^c por cada presentación, es independientemente H, alquiloC₁₋₇, -C(O)-O-alquiloC₁₋₇, o-CH₂C(O)OH; o

Como es evidente de la anterior captura de pantalla del Capítulo Reivindicatorio Modificado junto con mi respuesta al primer examen de fondo, la definición de los radicales X y X¹ está incompleta (el número de átomos del alquilo del grupo C(O)N(alquilo C₁₋₆)₂ y el número de grupos alquilo en el mismo), así como la definición del radical B¹ (que está explícitamente en la fórmula Markush ilustrada anteriormente) y dos definiciones del radical A¹.

Es decir, eliminar tales definiciones o definir las de manera incompleta no responde a la intención del solicitante, puesto que tal y como se explicó en mi respuesta al primer examen, las limitaciones incluidas en la Reivindicación 1 fueron:

- en la Reivindicación 1 se eliminó el grupo alquilo C₁₋₇ del alcance del sustituyente R¹, se eliminó el grupo alquileo C₁₋₇ lineal o ramificado de la definición de A¹ y se eliminaron los grupos arilo C₆₋₁₀, heteroarilo y heterocíclico de la definición de R²;

Por el contrario, la intención del solicitante era que la Reivindicación 1 presentara tales definiciones, y su ausencia en el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto a mi respuesta al primer examen de fondo responde únicamente a un error involuntario al momento de imprimir el documento. De hecho, si la misma sección se hubiese impreso bien, se habría visto lo siguiente:

X y X¹ son independientemente OH, -O-alquiloC₁₋₇, -NR^aR^b, -NHS(O)₂-alquiloC₁₋₇, -NHS(O)₂-bencilo u -O-ariloC₆₋₁₀; en donde el alquilo está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir del grupo que consiste en ariloC₆₋₁₀, heteroarilo, heterocíclico, C(O)NH₂, C(O)NH-alquiloC₁₋₆, y C(O)N(alquilo C₁₋₆)₂;

B¹ es -C(O)NH- o -NHC(O)-;

A¹ es un enlace; o

A¹ es un alquileo C₂₋₇ lineal o ramificado; o

Página 1 de 6

Expediente No. 11-165.101
Primer Examen de Fondo
P2011/000208

A¹ es un alquileo lineal C₁₋₄, en donde uno o más átomos de carbono es/son reemplazados con un heteroátomo seleccionado a partir de O, NR^c; y A¹ está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir del grupo que consiste en halógeno y alquiloC₁₋₇; en donde R^c por cada presentación, es independientemente H, alquiloC₁₋₇, -C(O)-O-alquiloC₁₋₇, o-CH₂C(O)OH; o

Las anteriores definiciones (el número de átomos del alquilo del grupo $C(O)N(\text{alquilo } C_{1-6})_2$ y el número de grupos alquilo en el mismo, la definición del radical B^1 y dos definiciones del radical A^1) son las que se encuentran en el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto al presente Recurso de Reposición, en el que simplemente se corrige un error de transcripción y no se pretende, como se podría desprender, incluir materia o modificar el alcance de la misma.

Anexo al presente recurso el capítulo reivindicatorio con las modificaciones señaladas y correctamente impreso, así como el recibo de consignación de la tasa oficial por modificaciones voluntarias.

c- Finalmente, ninguno de los documentos citados como arte previo en el primer examen de fondo de la presente solicitud (US5354892 -D1 y "Potent P1' biphenylmethylsubstitutedaggreacanaseinhibitors"⁴ -D2) afecta el nivel inventivo de la presente invención, en particular de las modalidades cubiertas por las definiciones que por error de impresión se excluyeron de la Reivindicación 1, ya que el sustituyente A^1 de la presente invención (equivalente a A en D1) **no** comprende el grupo alquileo C_{1-7} . En los compuestos de la presente invención A^1 representa un enlace directo, **un grupo alquileo C_{2-7}** , un grupo alquileo C_{1-4} **sustituido por un heteroátomo** (seleccionado entre O y NR^c), un fenilo, un heteroarilo, un cicloalquilo C_{3-7} , o un -alquilen C_{1-4} -arilo C_{6-10} -, -alquilen C_{1-4} -heteroarilo-, o -alquilen C_{1-4} -heterociclilo. De hecho, sin la definición del radical B^1 la Reivindicación 1 no tendría sentido, puesto que dicho radical se encuentra en la fórmula Markush de la Reivindicación 1.

Tal como lo expliqué en mi respuesta al primer examen de fondo, las diferencias estructurales entre la presente invención (que presenta las definiciones de los radicales X, X^1 , B^1 y A^1) y los compuestos de D1 y D2, así como las diferencias en la actividad farmacológica de los mismos, es posible concluir que una persona medianamente versada en la materia a la luz de las enseñanzas divulgadas por D1 y D2 explicadas arriba no habría sintetizado los compuestos reclamados en la presente invención. Por el contrario, al combinar las enseñanzas divulgadas por ambos documentos se obtendrían compuestos estructuralmente diferentes a los aquí reclamados, o con una actividad farmacológica distinta, lo cual evidencia el nivel inventivo de la presente invención.

⁴Yao, W., et al. "Potent P1' biphenylmethyl substituted aggreacanase inhibitors". Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters. Vol. 12, Issue 1, páginas 101-104, 2002.

4. SOLICITUD

Amparados en el artículo 34 de la Decisión 486 y en la interpretación que del mismo ha hecho el Tribunal de Justicia de la Comunidad Andina, solicitamos a la SIC aceptar el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto en el que se subsana el error de impresión en la primera página y se limita el alcance del radical R⁴ en la Reivindicación 3, las cuales no corresponden a una ampliación de la materia inicialmente divulgada ni concedida, ni se ven afectadas por el arte previo citado y analizado en el trámite, como en efecto quedó demostrado en la parte motiva de este recurso.

5. NOTIFICACIONES

Recibiré notificaciones en mis oficinas ubicadas en la Carrera 5 No. 34-03, de Bogotá.

Atentamente,


CARLOS R. OLARTE

C.C. No. 79.782.747 de Bogotá

T.P. 74295

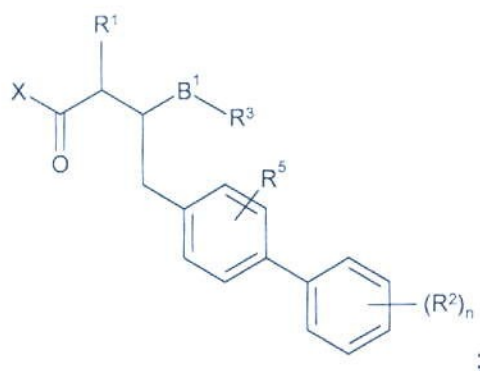
Anexos:

- Recibo de consignación de tasa por modificación voluntaria
- Capítulo Reivindicatorio Modificado.

CAPÍTULO REIVINDICATORIO MODIFICADO

(Recurso de Reposición)

1. Un compuesto de la Fórmula I':



Fórmula I'

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde:

R¹ es H, hidroxilo, alcoxilo C₁₋₇, halógeno, -SH, -S-alquiloC₁₋₇ o NR^aR^b;

R² por cada presentación, es independientemente alquiloC₁₋₇, halógeno, NO₂, CN, alcanoíloC₁₋₇, -amino, cicloalquiloC₃₋₇, hidroxilo, alcoxiloC₁₋₇, halo-alquiloC₁₋₇, -NR^aR^b, en donde R^a y R^b por cada presentación, son independientemente H o alquiloC₁₋₇;

R³ es Λ¹-C(O)X¹ o Λ²-R⁴;

R⁴ es ariloC₆₋₁₀, o un heteroarilo, el cual puede ser monocíclico o bicíclico, y el cual puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir del grupo que consiste en hidroxilo, hidroxi-alquiloC₁₋₇, nitro, -NR^aR^b, -C(O)-alquiloC₁₋₇, C(O)-O-alquiloC₁₋₇, alcoxiloC₁₋₇, halógeno, alquiloC₁₋₇, alquenoC₂₋₇, ariloC₆₋₁₀, heteroarilo, -NHSO₂-alquilo C₁₋₇ y bencilo;

o R⁴ es un heterociclilo, el cual puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir del grupo que consiste en oxo, hidroxilo, hidroxi-alquiloC₁₋₇, amino, C(O)-O-alquiloC₁₋₇, alcoxiloC₁₋₇, halógeno, alquiloC₁₋₇, halo-alquiloC₁₋₇, ariloC₆₋₁₀, heteroarilo, -NHSO₂-alquiloC₁₋₇ y bencilo;

R⁵ es H, halógeno, hidroxilo, alcoxiloC₁₋₇, halógeno, alquiloC₁₋₇, o halo-alquiloC₁₋₇;

y

X y X¹ son independientemente OH, -O-alquiloC₁₋₇, -NR^aR^b, -NHS(O)₂-alquiloC₁₋₇, -NHS(O)₂-bencilo u -O-ariloC₆₋₁₀; en donde el alquilo está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir del grupo que consiste en ariloC₆₋₁₀, heteroarilo, heterociclilo, C(O)NH₂, C(O)NH-alquiloC₁₋₆, y C(O)N(alquilo C₁₋₆)₂;

B¹ es -C(O)NH- o -NHC(O)-;

Λ¹ es un enlace; o

Λ¹ es un alquenoC₂₋₇ lineal o ramificado; o

11

Λ^1 es un alquileo lineal C_{1-4} , en donde uno o más átomos de carbono es/son reemplazados con un heteroátomo seleccionado a partir de O, NR^c ; y Λ^1 está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir del grupo que consiste en halógeno y alquilo C_{1-7} ; en donde R^c por cada presentación, es independientemente H, alquilo C_{1-7} , $-C(O)-O$ -alquilo C_{1-7} , $o-CH_2C(O)OH$; o

Λ^1 es un fenilo o un heteroarilo; cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir del grupo que consiste en alquilo C_{1-7} , cicloalquilo C_{3-7} , halo-alquilo C_{1-7} , hidroxilo, alcoxilo C_{1-7} , halógeno, $-NR^aR^b$, $-OCH_2CO_2H$ y $-OCH_2C(O)NH_2$; o

Λ^1 es un cicloalquilo C_{3-7} ;

Λ^1 es -alquilen C_{1-4} -arilo C_{6-10} -, -alquilen C_{1-4} -heteroarilo-, o -alquilen C_{1-4} -heterociclilo-; en donde Λ^1 puede estar en cualquier dirección; y

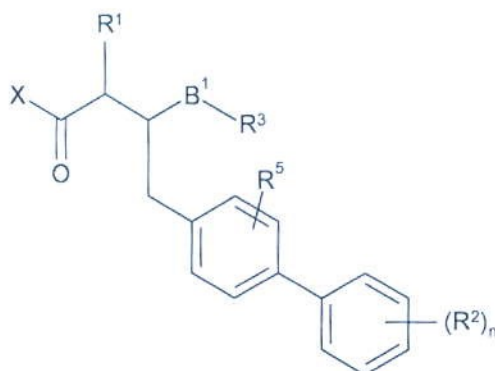
Λ^2 es un enlace o un alquileo C_{1-7} lineal o ramificado, que está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir del grupo que consiste en halógeno, alcoxilo C_{1-7} , hidroxilo, O-acetato y cicloalquilo C_{3-7} ;

n es 0, 1, 2, 3, 4 o 5;

en donde cada heteroarilo es un anillo aromático monocíclico o bicíclico que comprende de 5 a 10 átomos del anillo seleccionados a partir de átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos; y

cada heterociclilo es una fracción monocíclica saturada o parcialmente saturada, pero no aromática, la cual comprende de 4 a 7 átomos del anillo seleccionados a partir de átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos, en donde cada heteroátomo de un heteroarilo o de un heterociclilo se selecciona independientemente a partir de O, N y S.

2. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1 de la Fórmula I:



Fórmula I

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde:

R^1 es H o alquilo C_{1-7} ;

12

R^2 por cada presentación, es independientemente alquilo C_{1-7} , halógeno, NO_2 , CN, alcanóilo C_{1-7} -amino, cicloalquilo C_{3-7} , hidroxilo, alcoxilo C_{1-7} , $-NR^aR^b$; en donde R^a y R^b por cada presentación, son independientemente H o alquilo C_{1-7} ;

R^3 es $\Lambda^1-C(O)X^1$ o A^2-R^4 ;

R^4 es arilo C_{6-10} , o un heteroarilo, el cual puede ser monocíclico o bicíclico, y el cual puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir del grupo que consiste en hidroxilo, hidroxi-alquilo C_{1-7} , amino, $C(O)-O$ -alquilo C_{1-7} , alcoxilo C_{1-7} , halógeno, alquilo C_{1-7} , halo-alquilo C_{1-7} , arilo C_{6-10} , heteroarilo, $-NHISO_2$ -alquilo C_{1-7} y bencilo;

o R^4 es un heterociclilo, el cual puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir del grupo que consiste en oxo, hidroxilo, hidroxi-alquilo C_{1-7} , amino, $C(O)-O$ -alquilo C_{1-7} , alcoxilo C_{1-7} , halógeno, alquilo C_{1-7} , halo-alquilo C_{1-7} , arilo C_{6-10} , heteroarilo, $-NHISO_2$ -alquilo C_{1-7} y bencilo;

R^5 es H, halógeno, hidroxilo, alcoxilo C_{1-7} , halógeno, alquilo C_{1-7} , o halo-alquilo C_{1-7} ;

y

X y X^1 son independientemente OH, $-NR^aR^b$, u $-O$ -arilo C_{6-10} ; en donde el alquilo está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir del grupo que consiste en arilo C_{6-10} , heteroarilo, heterociclilo, $C(O)NH_2$, $C(O)NH$ -alquilo C_{1-6} , y $C(O)N$ (alquilo C_{1-6}) $_2$;

B^1 es $-C(O)NH-$ o $-NHC(O)-$;

Λ^1 es un enlace; o

Λ^1 es un fenilo o un heteroarilo; cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir del grupo que consiste en alquilo C_{1-7} , cicloalquilo C_{3-7} , halo-alquilo C_{1-7} , hidroxilo, alcoxilo C_{1-7} , halógeno, $-NR^aR^b$, $-OCH_2CO_2H$, y $-OCH_2C(O)NH_2$; o

Λ^1 es un cicloalquilo C_{3-7} ;

Λ^1 es -alquilen C_{1-4} -arilo C_{6-10} -, -alquilen C_{1-4} -heteroarilo-, o -alquilen C_{1-4} -heterociclilo-, en donde Λ^1 puede estar en cualquier dirección; y

Λ^2 es un enlace o un alquilen C_{1-7} lineal o ramificado, que está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir del grupo que consiste en halógeno, alcoxilo C_{1-7} , hidroxilo, O-acetato y cicloalquilo C_{3-7} ;

n es 0, 1, 2, 3, 4 o 5;

en donde cada heteroarilo es un anillo aromático monocíclico o bicíclico que comprende de 5 a 10 átomos del anillo seleccionados a partir de átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos; y

cada heterociclilo es una fracción monocíclica saturada o parcialmente saturada, pero no aromática, la cual comprende de 4 a 7 átomos del anillo seleccionados a partir de

13

átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos, en donde cada heteroátomo de un heteroarilo o de un heterociclilo se selecciona independientemente a partir de O, N y S.

3. El compuesto de la Reivindicación 1, en donde:

R^1 es H o alquilo C_{1-7} ;

R^2 por cada presentación, es independientemente alquilo C_{1-7} , halógeno, cicloalquilo C_{3-7} , hidroxilo, alcoxilo C_{1-7} , halo-alquilo C_{1-7} , $-NR^aR^b$; en donde R^a y R^b por cada presentación, son independientemente H o alquilo C_{1-7} ;

R^3 es $\Lambda^1-C(O)X^1$ o Λ^2-R^4 ;

R^4 es arilo C_{6-10} o un heteroarilo, cada uno de los cuales puede ser monocíclico o bicíclico, y cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir del grupo que consiste en hidroxilo, alcoxilo C_{1-7} , halógeno, alquilo C_{1-7} , halo-alquilo C_{1-7} , arilo C_{6-10} , heteroarilo, $-NHSO_2$ -alquilo C_{1-7} y bencilo;

R^5 es H; y

X y X^1 son independientemente OH, $-O$ -alquilo C_{1-7} o NR^aR^b ;

B^1 es $-C(O)NH-$ o $-NHC(O)-$;

Λ^1 es un fenilo o un heteroarilo; cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir del grupo que consiste en alquilo C_{1-7} , cicloalquilo C_{3-7} , halo-alquilo C_{1-7} , hidroxilo, alcoxilo C_{1-7} , halógeno, $-NR^aR^b$, $-OCH_2CO_2H$, y $-OCH_2C(O)NH_2$; y

Λ^2 es un enlace o un alquilenos C_{1-7} lineal o ramificado, el cual está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir del grupo que consiste en halógeno, alcoxilo C_{1-7} , hidroxilo, O-acetato, y cicloalquilo C_{3-7} ; y

n es 0, 1, 2, 3, 4 o 5;

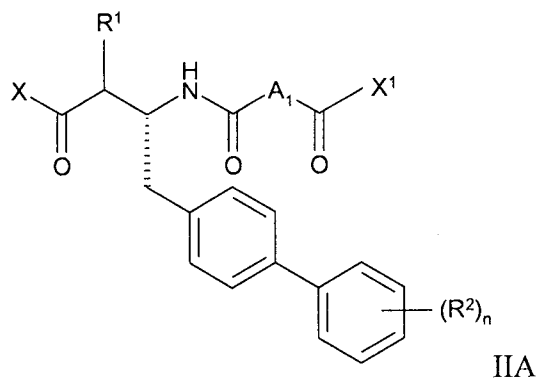
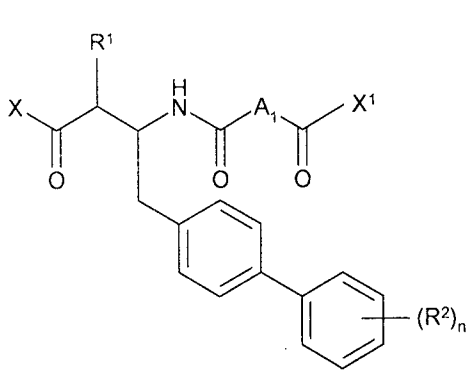
en donde cada heteroarilo es un anillo aromático monocíclico o bicíclico que comprende de 5 a 10 átomos del anillo seleccionados a partir de átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos; y

cada heterociclilo es una fracción monocíclica saturada o parcialmente saturada, pero no aromática, la cual comprende de 4 a 7 átomos del anillo seleccionados a partir de átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos, en donde cada heteroátomo de un heteroarilo o de un heterociclilo se selecciona independientemente a partir de O, N y S;

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

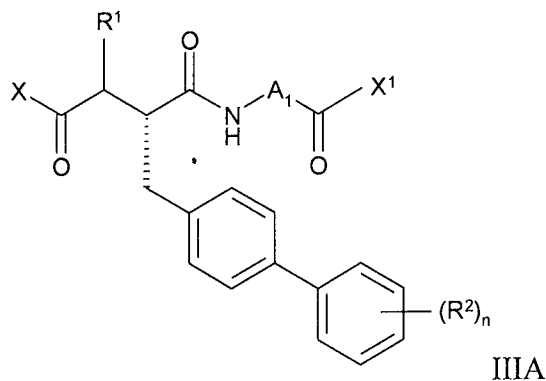
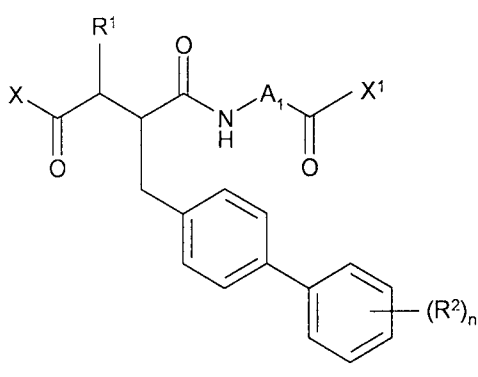
4. El compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, que tiene Fórmula II o IIA:

11



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

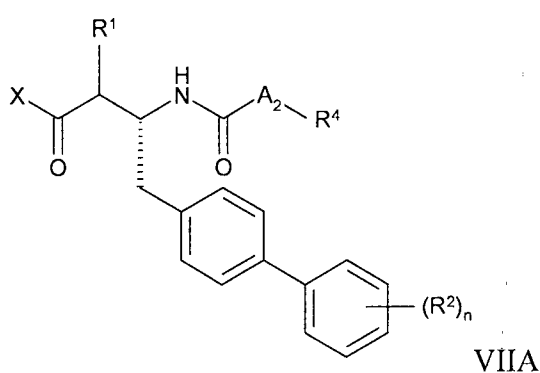
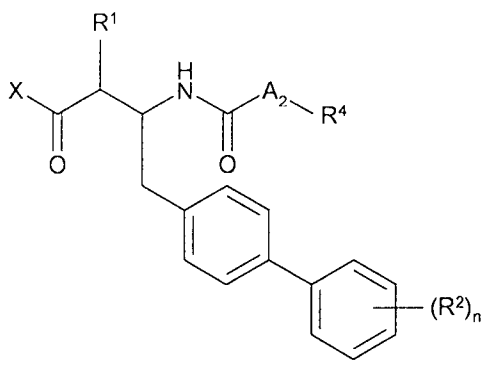
5. El compuesto de la Reivindicación 1, que tiene Fórmula III o IIIA:



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

6. El compuesto de la Reivindicación 1, en donde A¹ es un fenilo o heteroarilo opcionalmente sustituido, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

7. El compuesto de la Reivindicación 1, que tiene Fórmula VII o VIIA:



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

8. El compuesto de la Reivindicación 7, en donde A² es un enlace o CH₂ o CH₂-CH₂, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

9. El compuesto de las Reivindicaciones 1 a 4, en donde R¹ es H, R² es independientemente halógeno, alcoxiloC₁-7, hidroxilo, alquiloC₁-7, o halo-alquiloC₁-7, n es

15

0, 1 o 2, y X y X¹ son independientemente OH u -O-alquilo C₁₋₇, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

10. El compuesto de la Reivindicación 9, en donde n es 1 o 2; R² es meta-cloro o meta-fluoro, y el otro grupo R² opcional es halógeno, alquilo C₁₋₇, halo-alquiloC₁₋₇, hidroxilo y alcoxiloC₁₋₇, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

11. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 4, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, y uno o más vehículos farmacéuticamente aceptables.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800.176.089-2

-/-

16

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 14 - 0051658

Bogotá D.C., Mayo 15 de 2014 - 16:23:29

RECIBIDO DE : OLARTE MOURE & ASOCIADOS

NI 830.122.870

RE

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
RECIBO DE CA	999999999	51212	14/05/2014		515.000.00
RECIBO DE CA	999999999	51213	14/05/2014		515.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1 50005-01-03 CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICACIONES	EN N. CREACION CORRECCION A SOLICITUD EN TRAMITE / MODIFICA	128.000.00	128.000.00
			\$128.000.00

SON: **CIENTO VEINTIOCHO MIL PESOS MONEDA CORRIENTE**

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-165101- -00015-0000

Fecha: 2014-05-15 16:33:19 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 412 REPOSPRESRECU Folios: 16

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

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

, Mayo 15 de 2014 - 16:23:30