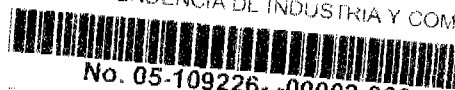


SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-109226- -00002-0000

Fecha: 2009-02-11 16:35:21 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Ever: 378 HASLNACIONALI
Act 329 CIOINFORMACION Folios: 18

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. S. D.

Re: P1.-WYETH.-Solicitud de Patente de Invención en Fase Nacional PCT para "INHIBIDORES DE FLUOR Y TRIFLUORALQUILO QUE CONTIENEN INHIBIDORES DE SULFONAMIDA HETEROCICLICOS DE LA PRODUCCIÓN BETA AMILOIDE Y DERIVADOS DE LOS MISMOS".-Clase C07D 333/34.-Expediente número 05-109.226.-

1. Me refiero a mi memorial de 10 de Noviembre de 2006.

2. Atentamente me permito manifestar a ese Despacho que es deseo del solicitante presentar un nuevo juego de 50 reivindicaciones que reemplaza el capítulo reivindicatorio originalmente presentado, en el que se ha eliminado el compuesto *5'-Cloro-N-[3,3,3-trifluor-2-(trifluormetil)-1-S-(hidroximetil)propil]tiofen-2'-sulfonamida* de la reivindicación número 11 y en el que se ha insertado la nueva reivindicación número 12, dependiente de la reivindicación 1 originalmente presentada, dirigida a proteger en forma específica el compuesto anteriormente mencionado. Adicionalmente y teniendo en cuenta lo anterior, se han reenumerado las reivindicaciones originales 12 a 49 como nuevas reivindicaciones 13 a 50, y se han modificado sus dependencias de conformidad con el cambio anteriormente señalado.

En relación con la anterior modificación, atentamente me permito manifestar a ese Despacho que la misma **no amplía** de ninguna manera el alcance de la presente invención y que el nuevo capítulo modificado es el que debe ser tenido en cuenta en el trámite de Fase Nacional.

JOSE LLORED A CAMACHO & CO.

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 6069700 Fax 6069701

3. Anexo me permito presentar:

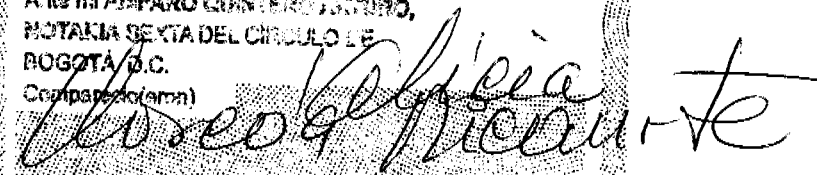
- (a) Formulario único de modificaciones y correcciones;
- (b) Recibo No.09-5,513, expedido por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago de la tasa de modificación;
- (c) Copia de las páginas **152 a 165** que corresponden al nuevo capítulo reivindicatorio que consta de **50** reivindicaciones, en el que se han hecho las modificaciones anteriormente mencionadas.

4. Ruego a usted tomar atenta nota de lo anterior y proceder de conformidad.

Señor Superintendente,


ALICIA LLORED A RICAURTE

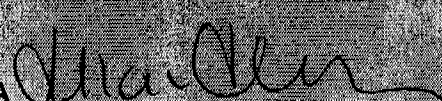
T.P. 53.215

NOTARIA SEXTA DE BOGOT A
RECONOCIMIENTO Y PRESENTACION PERSONAL
Bogotá, D.C. 10 FEB 2009
Ante mí AMPARO QUINTERO ARTURO,
NOTARIA SEXTA DEL CIRCULO DE
BOGOT A, D.C.
Comparecencia (enm)

Quien (o) comparecieron: la(s) C.C. No. 39.690.713
Y declararon; que la(s) firma(s) que se hizo(n)
en el presente documento es(son) la(s) suya(s) y
que el contenido del mismo es cierto.
En constancia se firma esta diligencia.


ALICIA LLORED A 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: WYETH, sociedad existente y organizada de conformidad con las leyes del Estado de Delaware, Estados Unidos de América. Dirección: Five Giralda Farms, Madison, NJ 07940 Estados Unidos de América Teléfono: 3 264270 Fax: 6 069701 E-mail: jllcco@lloredacamacho.com Domicilio: Madison, Estado de New Jersey, Estados Unidos de América	IDENTIFICACION C.C. ☐ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Número _____
3	REPRESENTANTE O APODERADO	Nombre: ALICIA LLOREDA RICAURTE Dirección: Calle 72 No. 5-83 5° Piso Teléfono: 3 264270 Fax: 6 069701 E-mail: jllcco@lloredacamacho.com	IDENTIFICACION C.C. ☒ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Número _____ TP _____
4 Número de expediente: <u>05-109.226</u>			
5 Descripción de la corrección o modificación solicitada <u>Nuevo Capítulo Reivindicatorio el cual consta de 50 Reivindicaciones.</u>			
6 Comprobante de pago No. <u>09-5.513</u> Fecha <u>Enero 23 de 2009</u>			
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 <u>ALICIA LLOREDA RICAURTE</u> FIRMA  C.C. <u>39.690.713</u> 53.215			

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

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 5,513
FECHA : ENERO 23 DE 2009

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-109226- -00002-0000

Fecha: 2009-02-11 16:35:21 Dep. 2020 NUECREACION
Tra 11 PATENTILYII Eje: 378 FASLACIONALI
Act 329 CTOINFORMACION Folios: 18

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
LLOREDA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	97134811	23/01/2009	6,515,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LENAS COMERCIALES	111,000.00
		TOTAL :	\$ 111,000.00

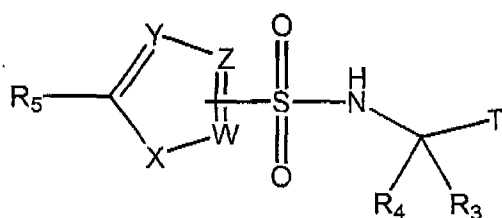
SON: CIENTO ONCE MIL PESOS

RESPONSABLE :

BO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.

REIVINDICACIONES

1. Compuesto de Fórmula (I), o una sal del mismo farmacéuticamente aceptable, en donde la Fórmula (I) tiene la estructura:



(I)

10

caracterizado porque:

T se selecciona del grupo que consiste de CHO, COR₈, y C(OH)R₁R₂;

R₁ y R₂ se seleccionan independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo inferior, alquilo inferior sustituido, CF₃, alquenilo, alquenilo sustituido, alquinilo y alquinilo sustituido.

R₃ se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo inferior y alquilo inferior sustituido;

R₄ se selecciona del grupo que consiste de (CF₃)_nalquilo, (CF₃)_n(alquilo sustituido), (CF₃)_nalquil fenilo, (CF₃)_nalquilo(fenilo sustituido), y (F)_ncicloalquilo;

n = 1-3;

R₅ se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, CF₃, dieno fusionado a Y cuando Y = C, y

25

756
157

dieno sustituido fusionado a Y cuando $Y = C$;

W, Y, y Z son seleccionados independientemente del grupo que consiste de C, CR_6 y N con la condición de que al menos uno de W o Y o Z deba ser C;

- 5 R_6 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, alquilo inferior, y alquilo inferior sustituido;

X se selecciona del grupo que consiste de O, S, SO_2 y NR_7 ;

- R_7 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo inferior, alquilo inferior sustituido, bencilo, bencilo sustituido, fenilo y fenilos sustituido; y
- 10

R_8 se selecciona del grupo que consiste de alquilo inferior, CF_3 , fenilo y fenilo sustituido;

o sales, hidratos o profármacos de los mismos farmacéuticamente aceptables.

- 15 2. Compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque R_5 es halógeno.

3. Compuesto de conformidad con la reivindicación 2, caracterizado porque R_5 es cloro, bromo o fluor.

4. Compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizado porque R_1 y R_2 son cada uno hidrógeno.
- 20

5. Compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado porque W es C y Z es CR_6 .

6. Compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado porque X es S, y W, Y, y Z se
- 25

seleccionan independientemente de C o CR₆, siempre que uno de W, Y o Z sea C.

7. Compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, caracterizado porque R₄ se selecciona del grupo que consiste de (CF₃)_nalquilo inferior, (CF₃)_n(alquilo inferior sustituido), (CF₃)_nalquil fenilo inferior, y (CF₃)_nalquilo inferior(fenilo sustituido) de estereoquímica S.

8. Compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque X es S, W es C, Y es CH, Z es CH, R₅ es cloro, R₄ es CF₃CH₃CHCH₃, R₃, R₁ y R₂ son cada uno hidrógeno, el cual tiene la estereoquímica 1S,2R.

9. Compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque X es S, W es C, Y es CH, Z es CH, R₅ es cloro, R₄ es CF₃CH₃CHCH₃, R₃, R₁ y R₂ son cada uno hidrógeno, el cual tiene la estereoquímica 1S.

10. Compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque W es N y X es NR₇.

11. Compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque el compuesto se selecciona del grupo que consiste de:

5-Cloro-N-[(1S,2R)-4,4,4-trifluor-1-(hidroximetil)-2-metilbutil]tiofen-2-sulfonamida;

5-Cloro-N-[(1S,2R)-2-etil-4,4,4-trifluor-1-(hidroximetil)butil]tiofen-2-sulfonamida;

25 5'-Cloro-N-[(1S,2R)-2-etil,4,4,4-trifluor-1-(1-

288
659

hidroxietil)butil]tiofen-2'-sulfonamida;

5'-Cloro-N-[3,3,3-trifluor-2-(trifluormetil)-1-

hidroximetil)propil]tiofen-2'-sulfonamida;

5-Cloro-N-[(1R,2S)-2-etil-4,4,4-trifluor-1-

5 (hidroximetil)butil]tiofen-2-sulfonamida;

5-Cloro-N-[4,4,4-trifluor-1-(hidroximetil)butil]tiofen-2-sulfonamida;

5-Cloro-N-{(1S,2R)-4,4,4-trifluor-1-[(1S)-1-hidroxietil]-2-metilbutil}tiofen-2-sulfonamida;

10 5-Cloro-N-{(1S,2R)-4,4,4-trifluor-1-[(1R)-1-hidroxietil]-2-metilbutil}tiofen-2-sulfonamida;

5-Cloro-N-[(1S,2S)-4,4,4-trifluor-1-(hidroximetil)-2-metilbutil]tiofen-2-sulfonamida;

(2S,3S)-2-(5-Cloro-3-metilbenzo[b]tiofen-2-sulfonil)-amido-
15 5,5,5-trifluor-3-etil-pentan-1-ol;

(2S,3R)-2-(5-Cloro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-sulfonil)-amino-5,5,5-trifluor-3-fenil-pentan-1-ol;

5-Cloro-N-[1-(4,4-difluorciclohexil)-2-hidroxietil]tiofen-2-sulfonamida;

20 5-Cloro-N-[1-(6,6-difluorbiciclo[3.1.0]hex-3-il)-2-hidroxietil]tiofen-2-sulfonamida;

5-Cloro-N-[(1S,2R)-4,4,4-trifluor-1-formil-2-metilbutil]tiofen-2-sulfonamida;

N-[(1S,2R)-1-Acetil-4,4,4-trifluor-2-metilbutil]-5-clorotiofen-2-sulfonamida;

25

259
164

- 5-Cloro-N-[(1S,2R)-4,4,4-trifluor-1-(1-hidroxi-1-metiletil)2-metilbutil]tiofen-2-sulfonamida;
- 4-Bromo-5-cloro-N-[3,3,3-trifluor-1-(hidroximetil)-2-(trifluormetil)propil]tiofen-2-sulfonamida;
- 5 4-Bromo-5-cloro-N-[(1S)-3,3,3-trifluor-1-(hidroximetil)-2-(trifluormetil)propil]tiofen-2-sulfonamida;
- 5-Cloro-4-fluor-N-[3,3,3-trifluor-1-(hidroximetil)-2-(trifluormetil)propil]tiofen-2-sulfonamida;
- 5-Bromo-N-[3,3,3-trifluor-1-(hidroximetil)-2-(trifluormetil)propil]tiofen-2-sulfonamida;
- 10 5-Fluor-N-[3,3,3-trifluor-1-(hidroximetil)-2-(trifluormetil)propil]tiofen-2-sulfonamida;
- 5-Bromo-N-[(1S)-3,3,3-trifluor-1-(hidroximetil)-2-(trifluormetil)propil]tiofen-2-sulfonamida;
- 15 5-Fluor-N-[(1S)-3,3,3-trifluor-1-(hidroximetil)-2-(trifluormetil)propil]tiofen-2-sulfonamida;
- 5-Cloro-N-[4,4,4-trifluor-1-(hidroximetil)-2-(2,2,2-trifluoretil)butil]tiofen-2-sulfonamida;
- 5-Cloro-N-[(1S)-(4,4,4-trifluor-1-(hidroximetil)-2-(2,2,2-trifluoretil)butil)]tiofen-2-sulfonamida;
- 20 4,5-Dicloro-N-[3,3,3-trifluor-1-(hidroximetil)-2-(trifluormetil)propil]tiofen-2-sulfonamida;
- N-[(1S)-3,3,3-Trifluor-1-(hidroximetil)-2-(trifluormetil)propil]tiofen-3-sulfonamida;
- 25 2,5-Dicloro-N-[(1S)-3,3,3-trifluor-1-(hidroximetil)-2-

- (trifluormetil)propil]tiofen-3-sulfonamida;
N-[(1S)-3,3,3-Trifluor-1-(hidroximetil)-2-(trifluormetil)propil]tiofen-2-sulfonamida;
4,5-Dicloro-N-[(1S)-3,3,3-trifluor-1-(hidroximetil)-2-(trifluormetil)propil]tiofen-2-sulfonamida;
5 (3,3,3-trifluor-1-hidroximetil-2-trifluormetil-propil)-amida del ácido tiofen-2-sulfónico;
(3,3,3-trifluor-1-hidroximetil-2-trifluormetil-propil)-amida del ácido tiofen-3-sulfónico;
10 (3,3,3-trifluor-1-hidroximetil-2-trifluormetil-propil)-amida del ácido 2,5-dicloro-tiofen-3-sulfónico;
4,5-Dibromo-N-[3,3,3-trifluor-1-(hidroximetil)-2-(trifluormetil)propil]tiofen-2-sulfonamida;
3-Bromo-5-cloro-N-[3,3,3-trifluor-1-(hidroximetil)-2-(trifluormetil)propil]tiofen-2-sulfonamida;
15 4-Bromo-2,5-dicloro-N-[3,3,3-trifluor-1-(hidroximetil)-2-(trifluormetil)propil]tiofen-2-sulfonamida;
(3,3,3-trifluor-1-(hidroximetil)-2-(trifluormetil)propil)-amida del ácido benzo[b]tiofen-2-sulfónico;
20 5-Cloro-(3,3,3-trifluor-1-hidroximetil-propil)-tiofen-2-sulfonamida;
y
5-Cloro-N-[(1S)-3,3,3-trifluor-1-[(1R)-1-hidroxietil]-2-(trifluormetil)propil]tiofen-2-sulfonamida; o una sal, hidrato o
25 profármaco del mismo, farmacéuticamente aceptable.

761
32

12. Compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque es 5'-Cloro-N-[3,3,3-trifluor-2-(trifluormetil)-1-S-(hidroximetil)propil]tiofen-2'-sulfonamida; o una sal, hidrato o profármaco del mismo, farmacéuticamente aceptable.

5 13. Compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque es 5-cloro-N-[(1S)-(4,4,4-trifluor-1-(hidroximetil)-2-(2,2,2-trifluoretil)butil)]tiofen-2-sulfonamida; o una sal, hidrato o profármaco del mismo, farmacéuticamente aceptable.

10 14. Compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque X es O, y W, Y, y Z se seleccionan independientemente de C o CR₆, siempre que uno de W, Y o Z sea C.

15 15. Compuesto de conformidad con la reivindicación 14, caracterizado porque R₅ es halógeno, R₄ se selecciona del grupo que consiste de (CF₃)_nalquilo inferior, (CF₃)_n(alquilo inferior sustituido), (CF₃)_nalquil fenilo inferior, y (CF₃)_nalquilo inferior(fenilo sustituido) de estereoquímica S, y R₃ y R₁ y R₂ son todos H.

20 16. Compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque T es C(OH)R₁R₂, R₁, R₂, y R₃ son H, y R₄ es (F)_ncicloalquilo.

17. Compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque T es C(OH)R₁R₂, R₁, R₂, y R₃ son H, y R₄ es (CF₃)_nalquilo.

25 18. Compuesto de conformidad con la reivindicación

1, caracterizado porque T es $C(OH)R_1R_2$, R_1 es CH_3 , R_2 es H, R_3 es H, y R_4 es $(CF_3)_n$ alquilo.

19. Compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque T es CHO, R_3 es H, y R_4 es $(CF_3)_n$ alquilo.

5 20. Compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque T es $C(OH)R_1R_2$, R_1 , R_2 y R_3 son H, y R_4 es $(CF_3)_2CH$ de estereoquímica S.

21. Compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque T es CHO, R_3 es H, y R_4 es
10 $CH(CH_3)CH_2CF_3$ de estereoquímica S.

22. Compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque T es $C(O)R_8$, R_3 es H, R_4 es $CH(CH_3)CH_2CF_3$ de estereoquímica S, y R_8 es CH_3 .

23. Compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque T es $C(OH)R_1R_2$, R_1 , R_2 y R_3 son H, y R_4
15 es $CH(CH_2CF_3)_2$ de estereoquímica S.

24. Compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque T es $C(OH)R_1R_2$, R_1 , R_2 y R_3 son H, y R_4 es $CH(CH_3)CH_2CF_3$ de estereoquímica S.

20 25. Compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque T es $C(OH)R_1R_2$, R_1 es CH_3 , R_2 y R_3 son H, R_4 es $CH(CF_3)_2$ de estereoquímica S.

26. Compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque T es $C(OH)R_1R_2$, R_1 , R_2 y R_3 son H, y R_4
25 es $(F)_n$ cicloalquilo.

263
169

27. Compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque la sal farmacéuticamente aceptable se selecciona del grupo que consiste de sales de ácidos orgánicos, sales de ácidos inorgánicos, sales de bases, y mezclas de las mismas.

5 28. Compuesto de conformidad con la reivindicación 27, caracterizado porque la sales de ácidos orgánicos e inorgánicos se seleccionan del grupo que consiste de ácido acético, ácido láctico, ácido cítrico, ácido tartárico, ácido succínico, ácido fumárico, ácido maleico, ácido malónico, ácido mandélico,
10 ácido malico, ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido fosfórico, ácido nítrico, ácido sulfúrico, ácido metansulfónico, ácido toluensulfónico y mezclas de las mismas.

 29. Compuesto de conformidad con la reivindicación 27, caracterizado porque las sales de bases se seleccionan
15 del grupo que consiste de hidróxido de sodio, hidróxido de litio e hidróxido de potasio y mezclas de las mismas.

 30. Composición farmacéutica, caracterizada porque comprende un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 29 y un portador fisiológicamente compatible.

20 31. Composición farmacéutica caracterizada porque comprende un profármaco de conformidad con cualquiera de los compuestos de las reivindicaciones 1 a 29 y un portador fisiológicamente compatible.

 32. Método para inhibir la producción beta
25 amiloide en un sujeto, caracterizado porque comprende las

etapas de suministrar un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 29, o una composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 30 ó 31.

33. Método de conformidad con la reivindicación 5 32, caracterizado porque dicho compuesto es suministrado oralmente, por inyección o por inhalación.

34. Método para tratar una enfermedad, caracterizado porque se selecciona del grupo que consiste de enfermedad de Alzheimer, angiopatía amiloide, angiopatía amiloide cerebral, amiloidosis sistémica, hemorragia cerebral hereditaria con amiloidosis del tipo Dutch, miositis de cuerpos de inclusión, deterioro cognitivo medio (MCI) y síndrome de Down, en un sujeto, dicho método comprende las etapas de administrar un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 29, 10 o una composición de conformidad con la reivindicación 30 ó 31 a dicho sujeto en una cantidad suficiente para aliviar los síntomas o el progreso de dicha enfermedad.

35. Kit farmacéutico, caracterizado porque comprende un recipiente que comprende una composición 20 farmacéutica de conformidad con la reivindicación 30 ó 31.

36. Método para preparar un compuesto de sulfonamida heterocíclica trifluormetilada o fluorada, caracterizado porque comprende las etapas de:

(a) filtrar una mezcla diastereomérica de un 25 aminoéster, dicho aminoéster que tiene al menos un centro

quiral y al menos, un grupo trifluormetilo o fluor unido al menos a un centro quiral a través de un grupo alquilo;

(b) tratar el aminoéster con DIBAL-H en tolueno para proporcionar N-bencilaminoalcohol;

5 (c) hidrogenar el N-bencilamino alcohol con un catalizador y proporcionar un aminoalcohol;

(d) sulfatar el amino alcohol de (c) con un cloruro de sulfonilo heterocíclico; y

(e) cristalizar el producto sulfonilado de (d) para
10 proporcionar el compuesto de sulfonamida heterocíclica trifluormetilado o fluorado quiralmente puro.

37. Método de conformidad con la reivindicación 36, caracterizado porque el compuesto de sulfonamida heterocíclica trifluormetilada es un compuesto de conformidad
15 con la reivindicación 1.

38. Método de conformidad con la reivindicación 37, caracterizado porque la etapa de cristalización se realiza usando acetato de etilo y hexanos.

39. Método para preparar un compuesto de
20 sulfonamida heterocíclica trifluormetilada o fluorada, caracterizado porque comprende las etapas de:

(a) tratar un aldehído trifluormetilado o fluorado con un agente de deshidratación y una sulfonamida quiral para formar una sulfonamida quiral trifluormetilada o fluorada;

25 (b) tratar dicha sulfonamida quiral

246
161

trifluormetilada o fluorada con un agente de cianación para formar un α -amino nitrilo diastereomérico trifluormetilado o fluorado.

(c) hidrolizar dicho α -amino nitrilo
5 diastereomérico trifluormetilado o fluorado a un α -aminoácido trifluormetilado;

(d) reducir dicho α -aminoácido trifluormetilado o fluorado a un β -amino alcohol trifluormetilado o fluorado; y

(e) hacer reaccionar dicho β -amino alcohol
10 trifluormetilado o fluorado con un cloruro de sulfonilo heterocíclico para formar dicha sulfonamida heterocíclica trifluormetilada o fluorada.

40. Método de conformidad con la reivindicación 39, caracterizado porque además comprende:

15 (f) extraer dicha sulfonamida heterocíclica trifluormetilada o fluorada.

41. Método de conformidad con la reivindicación 39 ó 40, caracterizado porque además comprende purificar dicha sulfonamida heterocíclica trifluormetilada o fluorada.

20 42. Método de conformidad con la reivindicación 41, caracterizado porque dicha sulfonamida heterocíclica trifluormetilada o fluorada es purificada usando cromatografía.

43. Método de conformidad con la reivindicación 39,

267
768

caracterizado porque dicho agente de deshidratación es etóxido de titanio, magnesio, sulfato, o tamices moleculares 4Å.

44. Método de conformidad con la reivindicación 39, caracterizado porque dicha sulfonamida quiral es S-(+)-
5 toluensulfinamida o t-butansulfonylamida.

45. Método de conformidad con la reivindicación 39, caracterizado porque dicho agente de cianación es cianuro de etil isopropoxi aluminio.

46. Método de conformidad con la reivindicación
10 39, caracterizado porque el agente de deshidratación es etóxido de titanio, dicha sulfonamida quiral es S-(+)-toluensulfinamida, y dicho agente de cianación es cianuro de etil isopropoxi aluminio.

47. Uso del compuesto de conformidad con
15 cualquiera de las reivindicaciones 1 a 29 o una composición de la reivindicación 30 ó 31, o dicha sales de los mismos aceptables en la preparación de un medicamento.

48. Uso del compuesto de conformidad con
20 cualquiera de las reivindicaciones 1 a 29, o una composición de la reivindicación 30 ó 31, en la preparación de un medicamento útil para administración a un sujeto mamífero para inhibir la producción beta amiloide.

49. Uso de conformidad con la reivindicación 48, caracterizado porque el compuesto se administra oralmente,
25 por inyección o por inhalación.

50. Uso del compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 29, o composición de la reivindicación 30 ó 31, en la preparación de un medicamento para tratar una enfermedad seleccionada del grupo

5 que consiste de enfermedad de Alzheimer, angiopatía amiloide, angiopatía amiloide cerebral, amiloidosis sistémica, hemorragia cerebral hereditaria con amiloidosis del tipo Dutch, miositis de cuerpos de inclusión, deterioro cognitivo medio (MCI) y síndrome de Down.

269
12/10

JOSE LLOREDA CAMACHO & CO.
ABOGADOS

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 6069700 Fax 6069701

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-109226-00005-0000

Fecha: 2010-03-19 16:24:26 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR

Tra: 11 PATENTINGII Evt: 378 FASENACIONALI

Act: 444 RESPUESTAREQUE Folio: 29

Re: P1.-WYETH.-Solicitud de Patente de Invención en Fase Nacional PCT para
"SULFONAMIDAS HETEROCÍCLICAS QUE CONTIENEN FLÚOR Y
TRIFLUORO ALQUILO INHIBIDORAS DE LA PRODUCCIÓN DE BETA
AMILOIDE Y DERIVADOS DE LAS MISMAS".-Clase CO7D 333/34.-
Expediente número 05-109.226.-

1. Me refiero al auto dictado por ese Despacho notificado por fijación en lista de 21 de Mayo de 2010.
2. Con el fin de responder las objeciones expuestas por el Señor Examinador en su Concepto Técnico No. **1705** en relación con la Claridad del Capítulo Reivindicatorio, su Unidad de Invención, la existencia de reivindicaciones excluidas de patentabilidad y relativas a Usos y el Nivel Inventivo de la presente solicitud, me permito presentar a continuación las siguientes modificaciones y argumentos técnicos en virtud de los cuales se superan completamente dichas objeciones.
3. **MODIFICACIONES VOLUNTARIAS-TÍTULO DE LA SOLICITUD.**

Antes de entrar a discutir las mencionadas objeciones, me permito manifestar que es deseo del solicitante enmendar un error involuntario cometido al momento de traducir el título de la solicitud original al idioma español.

De esta forma, la mencionada traducción no refleja de manera precisa lo expresado por el título que hace parte de la correspondiente solicitud internacional, restándole claridad a la presente solicitud.

Como consecuencia de lo anterior, se ha modificado el título de la solicitud en estudio para que se lea como sigue:

"Sulfonamidas heterocíclicas que contienen flúor y trifluoro alquilo inhibidoras de la producción de beta amiloide y derivados de las mismas"

270

JOSE LLORED A CAMACHO & CO.

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 6069700 Fax 6069701

En relación con lo anterior me permito señalar que esta modificación no constituye de ninguna manera una ampliación al alcance de la invención, tal como fue originalmente presentada, toda vez que se esta pretende únicamente mejorar la claridad de la solicitud, ajustándola al contenido presentado en la correspondiente solicitud internacional.

4. CLARIDAD DEL CAPÍTULO REIVINDICATORIO.

Respecto del capítulo reivindicatorio, me permito llamar la atención a ese Despacho al hecho que mediante memorial de Febrero 11 de 2009, el solicitante presentó una modificación al capítulo reivindicatorio originalmente presentado, la cual no ha sido tomada en consideración para el análisis de patentabilidad contenido en el Concepto Técnico No. **1705**.

Dicha modificación consistía en la introducción de una **nueva reivindicación 12**, la cual hace referencia específica a uno de los compuestos preferidos revelados dentro de la descripción de la solicitud, tal como se expone en mi mencionado memorial de modificación voluntaria de Febrero 11 de 2009.

Ruego entonces a ese Despacho, tomar en consideración la mencionada modificación y el capítulo reivindicatorio allí presentado.

En relación con lo anterior me permito señalar que, dado que la mencionada modificación no es sustancial y las objeciones presentadas por el Señor Examinador aplicarían de igual forma al capítulo reivindicatorio modificado, **en el presente escrito dichas objeciones serán discutidas tomando en consideración la nueva numeración incluida dentro del capítulo reivindicatorio modificado el 11 de Febrero de 2009.**

De esta forma, en el referenciado Concepto Técnico No. **1705** el Señor Examinador indica que el capítulo reivindicatorio actualmente presentado sería muy amplio, y que muchos de los significados de los sustituyentes sobre la fórmula (I) no estarían debidamente sustentados en los ejemplos específicos revelados en la descripción.

Sobre ese particular me permito señalar que es deseo del solicitante modificar el capítulo reivindicatorio actualmente en estudio de manera que refleje los compuestos que son específicamente ejemplificados en la descripción de la presente solicitud.