

JOSE LLOREDA CAMACHO & CO.

ABOGADOS

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

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COM
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-117701- -00006-0000

Fecha: 2011-01-28 16:32:27 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 8

Re: P1.-F.HOFFMANN-LA ROCHE AG.-Solicitud de Patente de Invención en Fase Nacional PCT para "DERIVADOS DE NAFTALINA ÚTILES COMO LIGANDOS DEL RECEPTOR HISTAMINA-3".-Clase A61K 31/435.- Expediente número 06-117.701.-

1. Me refiero al auto dictado por ese Despacho notificado por fijación en lista de 24 de Septiembre de 2010, así como a mi solicitud de plazo de 21 de Diciembre de 2010 para dar respuesta al auto arriba mencionado.

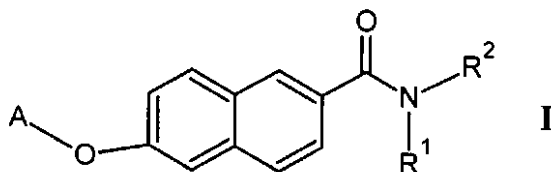
2. Con el fin de responder a las objeciones de claridad expuestas por el Señor Examinador en su Concepto Técnico No. **2942**, atentamente me permito presentar las siguientes modificaciones en el capítulo reivindicatorio de la solicitud, por medio de lo cual se superan completamente dichas objeciones.

3. **CLARIDAD DE LA DESCRIPCIÓN Y EL CAPÍTULO REIVINDICATORIO**

El señor Examinador menciona en su Concepto Técnico que los sustituyentes A, R¹ y R² de la fórmula (I) revelada en la presente solicitud de patente generan un gran número de compuestos que no corresponden a la invención de acuerdo a lo sustentado en la descripción.

Atendiendo lo anterior me permito señalar que el solicitante ha decidido limitar drásticamente el alcance del capítulo reivindicatorio, restringiéndolo a seis (6) reivindicaciones que se encuentran dirigidas a proteger lo siguiente:

- La nueva reivindicación 1 protege compuestos de fórmula general (I):



en la que

R^1 se selecciona entre el grupo constituido por hidrógeno y alquilo C_1-C_6 ;

R^2 se selecciona entre el grupo constituido por:

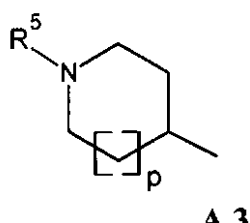
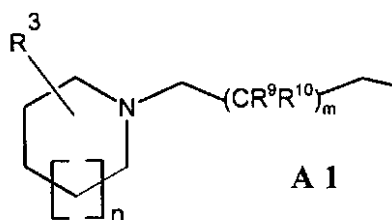
dialquilaminoalquilo C_1-C_6 ,

1-metil-pirrolidin-3-il, y

fenilalquilo C_1-C_6 , donde el anillo de fenilo está no sustituido o sustituido con uno o dos grupos seleccionados independientemente entre el grupo constituido por alquilo C_1-C_6 , halógeno, alcoxi C_1-C_6 e hidroxialquilo C_1-C_6 , ó,

R^1 y R^2 junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo heterocíclico seleccionado entre el grupo constituido por piperidina, piperazina, pirrolidino, tiomorfolino, morfolino y azepan, estando dicho anillo heterocíclico no sustituido o sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo constituido por alquilo C_1-C_6 , halógeno, halogenalquilo C_1-C_6 , hidroxí, hidroxialquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , oxo, fenilo no sustituido o sustituido con un grupo halogenalquilo C_1-C_6 , bencilo, piridilo, dialquilamino C_1-C_6 , carbamoilo y alquilsulfonilo C_1-C_6 , o estando condensado con un anillo de fenilo;

A se selecciona entre:



en la que

m es 0 ó 1;

n es 0 ó 1;

R^3 es hidrógeno o alquilo C_1-C_6 ;

R^9 y R^{10} son hidrógeno;

p es 0 ó 1;

R^5 es alquilo C_1-C_6 o cicloalquilo C_3-C_7 .

y sales farmacéuticamente aceptables de los mismos.

De lo anterior es claro que el alcance de la reivindicación 1 ha sido drásticamente limitado, de manera que ahora protege compuestos químicos plenamente soportados en la descripción de la solicitud; y

- Las nuevas reivindicaciones 2 a 6 son dependientes de la nueva reivindicación 1 y corresponden a las reivindicaciones 25 a 29 actualmente presentadas. Dichas reivindicaciones protegen compuestos químicos específicos, así como procesos de síntesis de tales compuestos y composiciones farmacéuticas que los contienen.

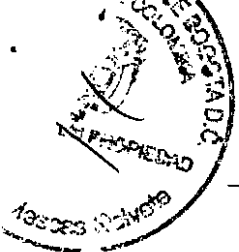
Visto lo anterior, me permito señalar que las modificaciones realizadas en el capítulo reivindicatorio de la solicitud no representan de manera alguna una ampliación de la solicitud presentada originalmente, cumpliendo por lo tanto a cabalidad con las disposiciones de patentabilidad establecidas en el artículo 34 de la Decisión 486 de 2000.

4. CONCLUSIÓN

De conformidad con lo mencionado en el presente memorial, me permito manifestar que el alcance del capítulo reivindicatorio de la solicitud en cuestión ha sido restringido a compuestos químicos plenamente soportados en la descripción. Adicionalmente me permito manifestar que las modificaciones realizadas cumplen a cabalidad con las disposiciones de patentabilidad establecidas en el artículo 34 de la Decisión 486 de 2000, toda vez que no amplían de manera alguna el alcance de la solicitud presentada originalmente.

Ahora bien, teniendo en cuenta que se han superado completamente las objeciones de claridad planteadas en el Concepto Técnico Nº 2942 y que el señor Examinador ya había reconocido previamente el nivel inventivo de la solicitud, es claro que la presente invención cumple con todos los requisitos para obtener el privilegio de patente solicitado.

5. Anexo al presente memorial me permito presentar una copia del nuevo capítulo reivindicatorio de la solicitud, el cual está conformado por seis (6) reivindicaciones y reemplaza al documento actualmente presentado.



JOSE LLORED A CAMACHO & CO.

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

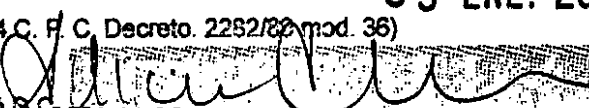
6. En vista de lo anterior, ruego a usted proceder a estudiar nuevamente la solicitud a la luz de las modificaciones y los argumentos presentados y conceder el privilegio de patente solicitado.

Señor Superintendente,

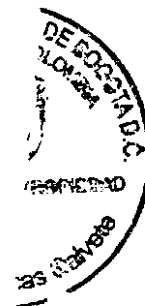

ALICIA LLORED A RICAURTE
T.P. 53.215

NOTARIA 41 DEL CIRCULO DE BOGOTÁ D.C.
DEPARTAMENTO DE CUNTA-MARCA
REPÚBLICA DE COLOMBIA

El Notario 41 del círculo de Bogotá, da fe de que compareció personalmente: Alicia Lloreda Ricaurte
identificada (o) con: 39.690.713 y tarjeta
profesional de abogado No. 53.215 del Consejo
Superior de la Judicatura, quien autentica la firma puesta por ella
(el) mismo en este escrito. **05 ENE. 2011**
(Art. 84 C. P. C. Decreto. 2282/82 mod. 36)

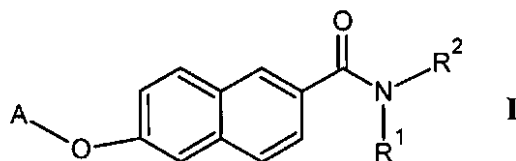

Bogotá ALICIA LLORED A RICAURTE
C.C. No. 39.690.713 de Usaquén
FIRMA DE LA (EL) COMPARECIENTE

Morales B. 
C.C. 1.015.73.013
VoBo.



REIVINDICACIONES

1. Compuestos de la fórmula general



5

en la que

R¹ se selecciona entre el grupo constituido por hidrógeno y alquilo C₁-C₆;

R² se selecciona entre el grupo constituido por:

10 dialquilaminoalquilo C₁-C₆,

1-metil-pirrolidin-3-il, y

fenilalquilo C₁-C₆, donde el anillo de fenilo está no sustituido o sustituido con uno o dos grupos seleccionados independientemente entre el grupo constituido por alquilo C₁-C₆, halógeno, alcoxi C₁-C₆ e hidroxialquilo C₁-C₆, ó,

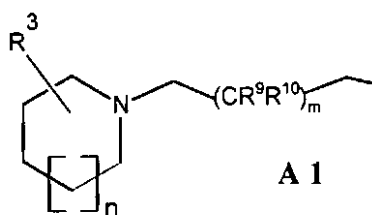
15

R¹ y R² junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo heterocíclico seleccionado entre el grupo constituido por piperidina, piperazina, pirrolidino, tiomorfolino, morfolino y azepan, estando dicho anillo heterocíclico no sustituido o sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo constituido por alquilo C₁-C₆, halógeno, halogenalquilo C₁-C₆, hidroxil, hidroxialquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, oxo, fenilo no sustituido o sustituido con un grupo halogenalquilo C₁-C₆, bencilo, piridilo, dialquilamino C₁-C₆, carbamoilo y alquilsulfonilo C₁-C₆, o estando condensado con un anillo de fenilo;

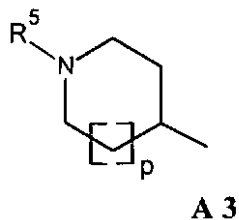
20

25

A se selecciona entre:



5



10 en la que

m es 0 ó 1;

n es 0 ó 1;

R³ es hidrógeno o alquilo C₁-C₆;R⁹ y R¹⁰ son hidrógeno;

15 p es 0 ó 1;

R⁵ es alquilo C₁-C₆ o cicloalquilo C₃-C₇;

y sales farmacéuticamente aceptables de los mismos.

20 2. Compuestos de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, seleccionados entre el grupo constituido por:

piperidin-1-il-[6-(3-piperidin-1-il-propoxi)-naftalen-2-il]-metanona,

(4-metil-piperidin-1-il)-[6-(3-piperidin-1-il-propoxi)-naftalen-2-il]-metanona,

25 (4-isopropil-piperazin-1-il)-[6-(3-piperidin-1-il-propoxi)-naftalen-2-il]-metanona,

(4-isopropil-piperazin-1-il)-{6-[2-(1-metil-piperidin-2-il)-etoxi]-naftalen-2-il}-metanona,

(2-metil-pirrolidin-1-il)-[6-(3-piperidin-1-il-propoxi)-naftalen-2-il]-metanona,

- (3,4-dihidro-1H-isoquinolin-2-il)-[6-(3-piperidin-1-il-propoxi)-naftalen-2-il]-metanona,
- (3,4-dihidro-1H-isoquinolin-2-il)-{6-[3-(2-metil-piperidin-1-il)-propoxi]-naftalen-2-il}-metanona,
- 5 [6-(3-piperidin-1-il-propoxi)-naftalen-2-il]-tiomorfolin-4-il-metanona,
- (4-metoxi-piperidin-1-il)-[6-(3-piperidin-1-il-propoxi)-naftalen-2-il]-metanona,
- [6-(3-piperidin-1-il-propoxi)-naftalen-2-il]-pirrolidin-1-il-metanona,
- {6-[3-(2-metil-piperidin-1-il)-propoxi]-naftalen-2-il}-pirrolidin-1-il-metanona,
- [6-(1-isopropil-piperidin-4-iloxi)-naftalen-2-il]-(4-metil-piperidin-1-il)-metanona,
- 10 [6-(1-isopropil-piperidin-4-iloxi)-naftalen-2-il]-(2-metil-pirrolidin-1-il)-metanona,
- (3,4-dihidro-1H-isoquinolin-2-il)-{6-[2-(1-metil-pirrolidin-2-il)-etoxi]-naftalen-2-il}-metanona,
- (3,4-dihidro-1H-isoquinolin-2-il)-[6-(1-isopropil-piperidin-4-iloxi)-naftalen-2-il]-metanona,
- 15 bencil-metil-amida del ácido 6-(1-isopropil-piperidin-4-iloxi)-naftalen-2-carboxílico,
- [6-(1-isopropil-piperidin-4-iloxi)-naftalen-2-il]-tiomorfolin-4-il-metanona,
- 3-metoxi-bencilamida del ácido 6-(1-isopropil-piperidin-4-iloxi)-naftalen-2-carboxílico,
- 20 [6-(1-isopropil-piperidin-4-iloxi)-naftalen-2-il]-morfolin-4-il-metanona,
- (4-isopropil-piperazin-1-il)-[6-(1-isopropil-pirrolidin-3-iloxi)-naftalen-2-il]-metanona,
- [6-(1-isobutil-piperidin-4-iloxi)-naftalen-2-il]-(4-isopropil-piperazin-1-il)-metanona,
- 25 [6-(1-isopropil-piperidin-4-iloxi)-naftalen-2-il]-piperidin-1-il-metanona,
- clorhidrato de metil-fenetil-amida del ácido 6-(3-piperidin-1-il-propoxi)-naftalen-2-carboxílico 1:1,
- clorhidrato de bencil-isopropil-amida del ácido 6-(3-piperidin-1-il-propoxi)-naftalen-2-carboxílico 1:1,

- clorhidrato de azepan-1-il-[6-(3-piperidin-1-il-propoxi)-naftalen-2-il]-metanona 1:1,
- clorhidrato de etil-(2-fluoro-bencil)-amida del ácido 6-(3-piperidin-1-il-propoxi)-naftalen-2-carboxílico 1:1,
- 5 clorhidrato de (2-dimetilamino-etil)-etil-amida del ácido 6-(3-piperidin-1-il-propoxi)-naftalen-2-carboxílico 1:2,
- clorhidrato de (4-bencil-piperidin-1-il)-[6-(3-piperidin-1-il-propoxi)-naftalen-2-il]-metanona 1:1,
- clorhidrato de (2-isopropil-pirrolidin-1-il)-[6-(3-piperidin-1-il-propoxi)-naftalen-2-
10 il]-metanona 1:1,
- clorhidrato de metil-(1-metil-pirrolidin-3-il)-amida del ácido 6-(1-isopropil-piperidin-4-iloxi)-naftalen-2-carboxílico 1:2,
- clorhidrato de [6-(1-isopropil-piperidin-4-iloxi)-naftalen-2-il]-[4-(4-trifluorometil-fenil)-piperazin-1-il]-metanona 1:1, y
- 15 [6-(1-ciclopropil-piperidin-4-iloxi)-naftalen-2-il]-morfolin-4-il-metanona,

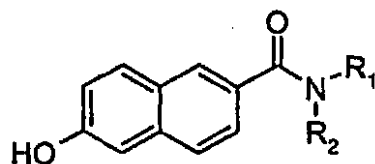
y sales farmacéuticamente aceptables de los mismos.

3. Compuestos de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1,
20 seleccionados entre el grupo constituido por:
- (4-metil-piperidin-1-il)-[6-(3-piperidin-1-il-propoxi)-naftalen-2-il]-metanona,
- (4-isopropil-piperazin-1-il)-[6-(3-piperidin-1-il-propoxi)-naftalen-2-il]-metanona,
- (3,4-dihidro-1H-isoquinolin-2-il)-[6-(3-piperidin-1-il-propoxi)-naftalen-2-il]-metanona,
- 25 [6-(3-piperidin-1-il-propoxi)-naftalen-2-il]-pirrolidin-1-il-metanona, y
- {6-[3-(2-metil-piperidin-1-il)-propoxi]-naftalen-2-il}-pirrolidin-1-il-metanona,

y sales farmacéuticamente aceptables de los mismos.

4. Un procedimiento para la fabricación de compuestos de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, comprendiendo dicho procedimiento:

a) hacer reaccionar un compuesto de fórmula II



II

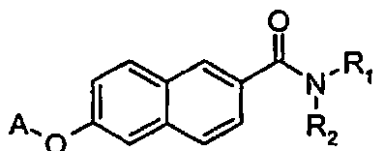
5 en la que R^1 y R^2 son como se han definido en la reivindicación 1, con un alcohol de fórmula III



en la que A es como se ha definido en la reivindicación 1,

en presencia de una trialquilfosfina o trifenilfosfina y de un compuesto

10 diazo para obtener un compuesto de fórmula I



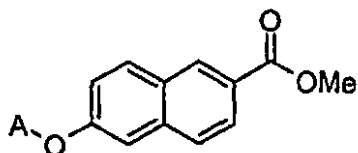
I

y si se desea,

convertir el compuesto obtenido en una sal de adición de ácidos farmacéuticamente aceptable,

15 o, como alternativa,

b) acoplar un compuesto de fórmula VII



VII

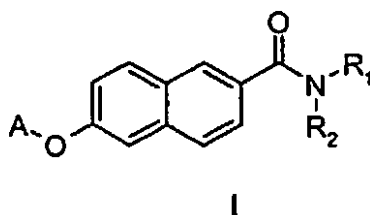
en la que A es como se ha definido en la reivindicación 1,

con una amina de fórmula V



20

en la que R^1 y R^2 son como se han definido en la reivindicación 1, en condiciones básicas para obtener un compuesto de fórmula I



y si se desea,

5 convertir el compuesto obtenido en una sal de adición de ácidos farmacéuticamente aceptable.

5. Compuestos de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3
cuando se fabrican mediante un procedimiento de acuerdo con la reivindicación
10 4.

6. Composiciones farmacéuticas que comprenden un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 así como un vehículo y/o adyuvante farmacéuticamente aceptable.

15