

OLARTEMOURE

OLARTE MOURE & ASOCIADOS LTDA.

Carlos R. Olarte
Juan G. Moure

Alexander Agudelo
Carlos A. Parra
Juan Felipe Acosta
Andrés Rincón
Mónica Guevara
Andrés Alvarado
Ella Ponce
Liliana Galindo
María Clara Calderón
Mauricio Ávila
Laura Escobar
José Jairo Dangond
Gina Cáceres
Isabella Herrera
Zaava Ravid

Medellín

María Clara Múnera

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 13-040966- -00005-0000

Fecha: 2013-05-10 16:26:48 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 12

Re: Expediente N° 13-040.966

Solicitud de Patente de Invención titulada: “PROCESO PARA LA PREPARACIÓN DE INTERMEDIOS DE 1-ARIL-PIRAZOL-3-ONA ÚTILES EN LA SÍNTESIS DE INHIBIDORES DE RECEPTORES SIGMA”

Solicitante: ESTEVE QUIMICA, S.A.

Nuestra Ref.: P2012/000142

RESPUESTA AL OFICIO N° 5030 NOTIFICADO

POR FIJACION EN LISTA No. 011, DE FECHA 12 DE MARZO DE 2013,

(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 Capítulo Reivindicatorio Modificado en donde:

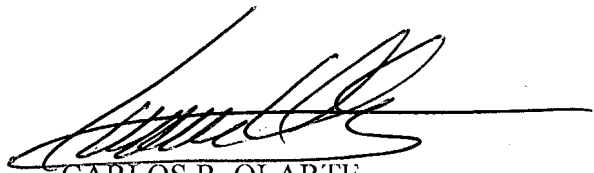
OLARTEMOURE

OLARTE MOURE & ASOCIADOS LTDA.

- Se eliminan las Reivindicaciones 3 a 5 y 9.
- En la actual Reivindicación 3, se aclara que el nombre del compuesto “diisopropilcarbodiimida” corresponde a una (DCI) de acuerdo con la publicación internacional, número WO2012/013755.
- La actual Reivindicación 11 (antigua Reivindicación 15) ahora reclama un método de preparación de un compuesto y no un uso.

Las demás reivindicaciones, así como sus relaciones de dependencia se reenumeran de acuerdo a los cambios realizados, quedando 15 reivindicaciones en total. Para tal efecto adjunto un recibo de pago por valor de \$150.000 que cubre la tasa correspondiente a 5 reivindicaciones adicionales.

Atentamente,



CARLOS R. OLARTE
CC. No.79.782.747 de Bogotá
T.P. 74.295

Adjunto: Capítulo Reivindicatorio modificado
 Recibo por valor de \$150.000

3

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO NIT : 800.176.089-2 - / -					
 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA	RECIBO DE CAJA			No. 13 - 0040689	
				Bogotá D.C., Abril 30 de 2013 - 12:12:26	
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	532438222	29/04/2013	7.078.000.00
*** Conceptos Pagados ***					
CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO	
2 50005-01-01	SOLICITUDES	1607 REIVINDICACION PATENTE UNITARIA ADICIONAL A LAS 10 INIC	30.000.00	60.000.00	
				\$60.000.00	
			=====		
SON: **SESENTA MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***					
Responsable: 					
*****_					
Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____					
Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C.- Colombia					
Web: www.sic.gov.co e-mai: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Línea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240					
, Abril 30 de 2013 - 12:12:28					

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -



RECIBO DE CAJA

No. 13 - 0040694

Bogotá D.C., Abril 30 de 2013 - 12:12:26

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	532438222	29/04/2013	7.078.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
3	50005-01-01 SOLICITUDES	1607 REIVINDICACION PATENTE UNITARIA ADICIONAL A LAS 10 INIC	30.000.00	90.000.00
				\$90.000.00

SON: **NOVENTA MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

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

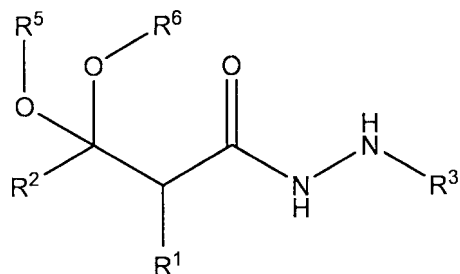
Web: www.sic.gov.co e-mai: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Línea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

, Abril 30 de 2013 - 12:12:28

5

CAPITULO REIVINDICATORIO MODIFICADO
(Modificaciones Voluntarias)

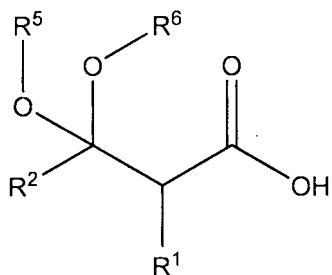
1. Proceso para la preparación de un compuesto de fórmula (V),



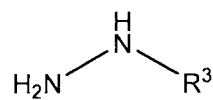
(V);

comprendiendo dicho proceso la etapa de:

a1) acoplar un compuesto de fórmula (II) con un compuesto de fórmula (IV) en un disolvente adecuado, en presencia de un agente de acoplamiento, y opcionalmente en presencia de un agente desactivador del agente de acoplamiento; o

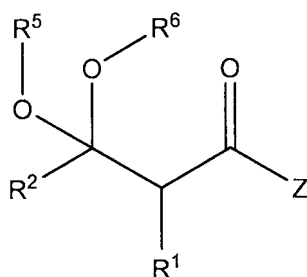


(II);



(IV);

a2) convertir un compuesto de fórmula (II) en un compuesto de fórmula (III) con un agente activador, y acoplar dicho compuesto de fórmula (III) con un compuesto de fórmula (IV) en un disolvente adecuado,



(III);

donde en cada uno de los compuestos de fórmula (II), (III), (IV), y (V), donde sea aplicable,

R¹ es hidrógeno o C₁₋₆alquilo;

R² es hidrógeno, C₁₋₆alquilo, o fenilo;

R³ es naftilo opcionalmente sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados entre halógeno y C₁₋₆alcoxi;

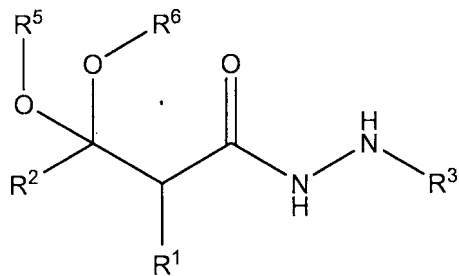
R⁵ y R⁶ son, cada uno independientemente, C₁₋₆alquilo, polihaloC₁₋₆alquilo, -C(=O)-C₁₋₆alquilo, fenilo, bencilo opcionalmente sustituido con nitro; o junto con los dos átomos de oxígeno a los que están unidos, forman un anillo heterocíclico de 4-7 miembros opcionalmente sustituido con un sustituyente seleccionado entre halógeno, C₁₋₆alquilo, C₂₋₆alquenilo, polihaloC₁₋₆alquilo, triC₁₋₆alquilsililo, diC₁₋₆alquilfenilsililo, C₁₋₆alquildifenilsililo, triC₁₋₆alquilsililC₁₋₆alquilo, diC₁₋₆alquilfenilsililC₁₋₆alquilo, C₁₋₆alquildifenilsililC₁₋₆alquilo, fenilo opcionalmente sustituido con nitro o metoxi, y piridilo; o el anillo heterocíclico de 4-7 miembros está opcionalmente sustituido con dos sustituyentes seleccionados entre halógeno y C₁₋₆alquilo;

Z representa halógeno, -O-CO-R⁷, o -O-CO-OR⁷; y

R⁷ es C₁₋₄alquilo, arilo o bencilo.

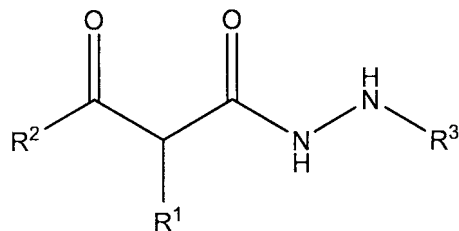
2. Proceso según la Reivindicación 1, en el que el grupo cetral o acetal del compuesto de fórmula (V) se separa posteriormente en un disolvente adecuado;

2



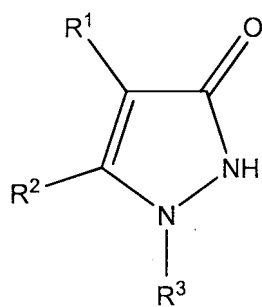
(V);

formando de este modo el compuesto de fórmula (VI),

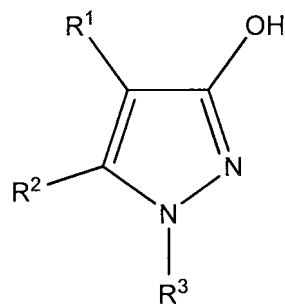


(VI);

y permitiendo la ciclación del compuesto de fórmula (VI), obteniendo de este modo el compuesto de fórmula (VII), un tautómero (VIIa), y sales de los mismos;



(VII);



(VIIa);

donde en cada uno de los compuestos de fórmulas (V), (VI), (VII), y (VIIa),

R¹, R², R³, R⁵, y R⁶ son tal como se definen en la Reivindicación 1.

3. Proceso según cualquiera de las Reivindicaciones 1-2, donde el agente de acoplamiento en la etapa a1) es una carbodiimida, preferiblemente

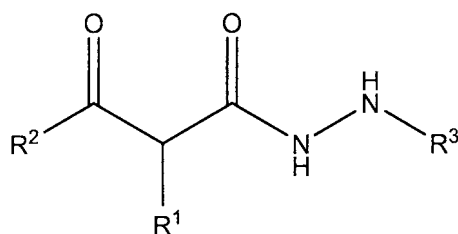
diciclohexilcarbodiimida (DCC), diisopropilcarbodiimida (DIC), o N-etil-N'-[(3dimetilamino)propil]carbodiimida (EDC).

4. Proceso según cualquiera de las Reivindicaciones 1-3, donde el agente activador del agente de acoplamiento en la etapa a1) se selecciona entre 1-hidroxibenzotriazol (HOBt) y 4-dimetilaminopiridina (4-DMAP).

5. Proceso según cualquiera de las Reivindicaciones 1-2, donde el agente activador en la etapa a2) se selecciona entre un agente halogenante, haluro de C₁₋₄alquil ácido, haluro de aril ácido, haluro de bencil ácido, haloformiato de C₁₋₄alquilo, haloformiato de arilo, y haloformiato de bencilo.

6. Proceso según la Reivindicación 2, donde la separación del grupo cetal o acetal del compuesto de fórmula (V) se realiza mediante tratamiento ácido en un medio acuoso, un disolvente orgánico o una mezcla de los mismos.

7. Compuesto de fórmula (VI), una sal, o estereoisómero del mismo,

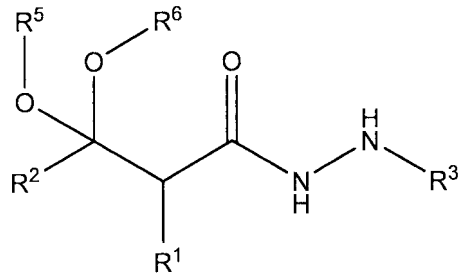


(VI);

donde, R¹, R², y R³ son tal como se definen en la Reivindicación 1.

8. Compuesto de fórmula (V), una sal, o estereoisómero del mismo,

9

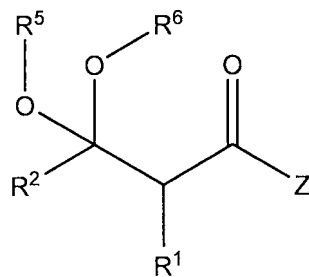


(V);

donde, R¹, R², y R³ son tal como se definen en la Reivindicación 1; y

R⁵ y R⁶ son, cada uno independientemente, C₁₋₆alquilo, polihaloC₁₋₆alquilo, acetilo, fenilo, bencilo, 2-nitrobencilo; o junto con los dos átomos de oxígeno a los que están unidos, forman un anillo heterocíclico de 4-7 miembros opcionalmente sustituido con un sustituyente seleccionado entre halógeno, C₁₋₆alquilo, C₂₋₆alquenilo, haloC₁₋₆alquilo, trimetilsilil, trimetilsililmetil, fenil, 2-nitrofenil, 4-metoxifenil, 2-piridilo; o el anillo heterocíclico de 4-7 miembros está opcionalmente sustituido con dos sustituyentes seleccionados entre halógeno y C₁₋₆alquilo.

9. Compuesto de fórmula (III), una sal, o estereoisómero del mismo,



(III);

donde, R¹ es hidrógeno o C₁₋₆alquilo;

R² es hidrógeno, C₁₋₆alquilo, o fenilo;

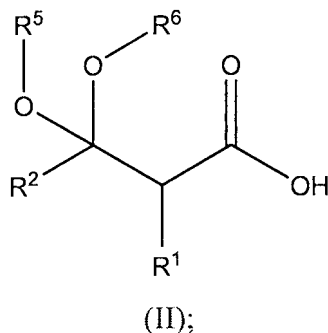
R⁵ y R⁶ son, cada uno independientemente, etilo, butilo, o junto con los dos átomos de oxígeno a los que están unidos, forman un anillo heterocíclico de 4-7 miembros sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados entre halógeno, C₁₋₆alquilo, C₂₋₆alquenilo, polihaloC₁₋₆alquilo, triC₁₋₆alquilsililo,

diC₁₋₆alquilfenilsililo, C₁₋₆alquildifenilsililo, triC₁₋₆alquilsililC₁₋₆alquilo, diC₁₋₆alquilfenilsililC₁₋₆alquilo, C₁₋₆alquildifenilsililC₁₋₆alquilo, fenilo opcionalmente sustituido con nitro o metoxi, y piridilo; o el anillo heterocíclico de 4-7 miembros está sustituido con dos sustituyentes seleccionados entre halógeno y C₁₋₆alquilo;

Z representa halógeno, -O-CO-R⁷, o -O-CO-OR⁷; y

R⁷ es C₁₋₄alquilo, arilo o bencilo.

10. Compuesto de fórmula (II), una sal, o un estereoisómero del mismo,



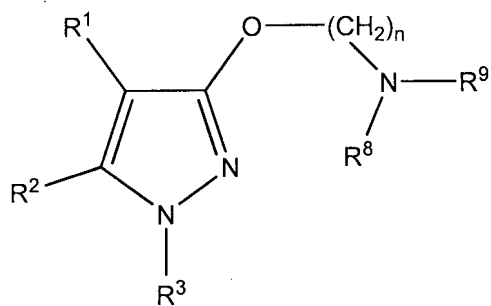
Donde R¹ es hidrógeno;

R² es metilo;

R⁵ y R⁶ son, cada uno independientemente, C₃₋₇alquilo; o junto con los dos átomos de oxígeno a los que están unidos, forman un anillo heterocíclico de 4-7 miembros sustituido con un sustituyente seleccionado entre halógeno, C₁₋₆alquilo, C₂₋₆alquenilo, polihaloC₁₋₆alquilo, triC₁₋₆alquilsililo, diC₁₋₆alquilfenilsililo, C₁₋₆alquildifenilsililo, triC₁₋₆alquilsililC₁₋₆alquil, diC₁₋₆alquilfenilsililC₁₋₆alquilo, C₁₋₆alquildifenilsililC₁₋₆alquilo, fenilo opcionalmente sustituido con nitro o metoxi, y piridilo; o el anillo heterocíclico de 4-7 miembros está sustituido con un halógeno y un C₁₋₆alquilo.

15. Proceso para la preparación de un compuesto de fórmula (X),

11



(X);

donde, R¹, R², y R³ son tal como se define en la reivindicación 1;

n es 2, 3, ó 4; y

R⁸ y R⁹ son, cada uno independientemente, C₁₋₆alquilo, C₁₋₆alcoxiC₁₋₆alquilo, bencilo, o junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un morfolinilo opcionalmente sustituido con C₁₋₆alquilo; tiomorfolinilo; piperacinilo opcionalmente sustituido con C₁₋₆alquilo, C₁₋₆alquilcarbonilo, o C₁₋₆alcoxycarbonilo; piperidinilo opcionalmente sustituido con C₁₋₆alquilcarbonilo, fenilo, o 3H-imidazo[4,5-b]piridinil; pirrolidinilo opcionalmente sustituido con amino o C₁₋₆alquilcarboniloamino; pirazolinilo; 1,2,3,4-tetrahidroisoquinolinilo; o 3H-imidazo[4,5-b]piridinilo que comprende la utilización de un compuesto de fórmula (VI), (V), (III), (II), (I), una sal, o estereoisómero del mismo, tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 7-10, según sea aplicable, como intermedio.



ANEXO EXPLICATIVO DE LAS MODIFICACIONES

Se eliminan las Reivindicaciones 3 a 5 y 9.

En la actual Reivindicación 3, se aclara que el nombre del compuesto “diisopropilcarbodiimida” corresponde a una (DCI) de acuerdo con la publicación internacional, número WO2012/013755.

La actual Reivindicación 11 (antigua Reivindicación 15) ahora reclama un método de preparación de un compuesto y no un uso.

Las demás reivindicaciones, así como sus relaciones de dependencia se reenumeran de acuerdo a los cambios realizados.