

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

División de Nuevas Creaciones

E. S. D.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-086360- -00005-0000

Fecha: 2011-05-18 17:02:05 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYH Eje. 378 FASENACIONALI
Act. 523 RESPUESTA Folios: 12

Expediente: 07.086.360
Titular: **AICURIS GMBH & CO. KG**
Asunto: CONTESTACIÓN A REQUERIMIENTO.

MAURICIO PATIÑO BONNET, mayor de edad, vecino de esta ciudad, identificado como aparece al pie de mi firma, portador de la tarjeta profesional número 73.583 del Consejo Superior de la Judicatura, en mi calidad de apoderado de **AICURIS GMBH & CO. KG**, por medio del presente memorial acudo a la División de Nuevas Creaciones de la Superintendencia de Industria y Comercio con el fin de **DAR RESPUESTA** al Acción Oficial No. 5150, de acuerdo como sigue:

CLARIDAD, REIVINDICACIONES RELATIVAS A UN USO Y EXCEPCIÓN DE PATENTABILIDAD

Con el fin de superar las objeciones que por claridad, reivindicaciones relativas a un uso y excepciones de patentabilidad planteó su Despacho, presento nuevo pliego reivindicatorio compuesto por siete (7) reivindicaciones, en el cual se han realizado las siguientes modificaciones. A saber:

- i. Las reivindicaciones 5 y 9 que caracterizan un compuesto químico y una composición por el tratamiento terapéutico han sido eliminadas del actual pliego reivindicatorio.
- ii. La reivindicación 10 ha sido eliminada del actual pliego de reivindicaciones a los efectos de evitar toda observación relativa a excepciones de patentabilidad.

2

iii. Las reivindicaciones 7 y 8 relacionadas con el uso del compuesto han sido eliminadas del actual pliego de reivindicaciones.

Adicional a lo anterior y en aras de especificar inequívocamente el alcance de protección de la invención:

iv. La anterior reivindicación 4 relacionada con el método para preparar el compuesto se ha dividido en las actuales reivindicaciones 4, 5 y 6 para definir las diferentes modalidades del métodos de preparación de los compuestos según la invención.

Adicionalmente, se han adicionado las definiciones de todos los componentes implicados en las reacciones, así como, las condiciones en que dichas reacciones se llevan a cabo.

v. La actual reivindicación 7 (anterior reivindicación 6) define los excipientes comprendidos en el medicamento reivindicado.

Me permito anotar que las modificaciones realizadas al pliego reivindicatorio no amplían la materia objeto de protección, sino por el contrario especifican la misma, permitiendo una interpretación inequívoca del alcance de protección y su comparación con el estado del arte. En consecuencia, las mismas se encuentran en concordancia con los lineamientos de los artículos 30 y 34 de la D.486.

Así las cosas, las modificaciones al nuevo pliego reivindicatorio dan por superadas las objeciones que por claridad, reivindicaciones relativas a un uso y excepciones de patentabilidad planteó su Despacho, puesto que se está reivindicando un compuesto, su proceso de preparación y medicamento de conformidad con el artículo 14 y 30 de la D. 486.

RENUNCIA AL TÉRMINO

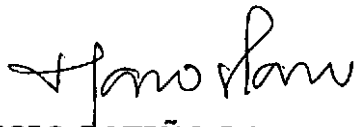
De conformidad con el Comunicado de Prensa 16 del 1 de abril de 2011 de la Superintendencia de Industria y Comercio renuncio al término faltante del tiempo concedido.

ANEXOS

i. Nuevo pliego reivindicatorio compuesto por siete (7) reivindicaciones.

De acuerdo con todo lo expuesto, solicito en forma muy comedida y respetuosa a la Sr. Jefe de la División de Nuevas Creaciones se sirva tener en cuenta las manifestaciones y documentos aportados junto con el presente memorial y, de conformidad con ello, se sirva continuar con el trámite de la solicitud de patente de la referencia.

Del señor Jefe de la División de Nuevas Creaciones,



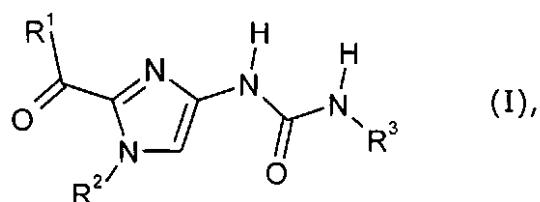
MAURICIO PATIÑO BONNET

C.C. 11.342.699 de Zipaquirá

✗ **T.P. 73583 del C.S. de la J.**

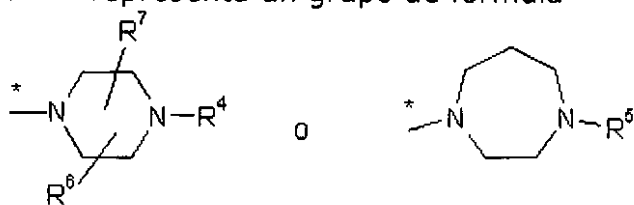
REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula



donde

R¹ representa un grupo de fórmula



donde

* representa el sitio de enlace con el grupo carbonilo,

R⁴ representa fenilo o heteroarilo de 5 ó 6 miembros,

donde el fenilo y el heteroarilo pueden estar sustituidos con entre 1 y 3 sustituyentes, donde los sustituyentes se seleccionan de forma mutuamente independiente del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, oxo, nitro, ciano, trifluorometilo, difluorometilo, trifluorometoxilo, difluorometoxilo, monofluorometoxilo, trifluorometiltiol, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxilo, hidroxicarbonilo, C₁-C₆-alcoxycarbonilo, amino, C₁-C₆-alquilamino, aminocarbonilo y C₁-C₆-alquilaminocarbonilo,

R⁵ representa fenilo o heteroarilo de 5 ó 6 miembros,

donde el fenilo y el heteroarilo pueden estar sustituidos con entre 1 y 3 sustituyentes, donde los sustituyentes se seleccionan de forma mutuamente independiente del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, oxo, nitro, ciano, trifluorometilo, difluorometilo, trifluorometoxilo, difluorometoxilo, monofluorometoxilo, trifluorometiltiol, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-

alcoxilo, hidroxicarbonilo, C₁-C₆-alcoxicarbonilo, amino, C₁-C₆-alquilamino, aminocarbonilo y C₁-C₆-alquilaminocarbonilo,

y

R⁶ y R⁷ independientemente representan hidrógeno, metilo o etilo,

R² representa C₁-C₆-alquilo,

donde el alquilo puede estar sustituido con un sustituyente, donde el sustituyente se selecciona del grupo que consiste en C₃-C₆-cicloalquilo, C₆-C₁₀-arilo y heteroarilo de 5 ó 6 miembros,

donde el cicloalquilo, el arilo y el heteroarilo pueden estar sustituidos con entre 1 y 3 sustituyentes, donde los sustituyentes se seleccionan de forma mutuamente independiente del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, oxo, nitro, ciano, trifluorometilo, difluorometilo, trifluorometoxilo, difluorometoxilo, monofluorometoxilo, trifluorometiltiol, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxilo, hidroxicarbonilo, C₁-C₆-alcoxicarbonilo, amino, C₁-C₆-alquilamino, aminocarbonilo y C₁-C₆-alquilaminocarbonilo,

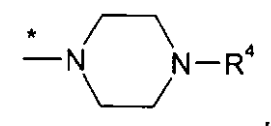
R³ representa fenilo,

donde el fenilo puede estar sustituido con entre 1 y 3 sustituyentes, donde los sustituyentes se seleccionan de forma mutuamente independiente del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, trifluorometilo, difluorometilo, trifluorometoxilo, difluorometoxilo, monofluorometoxilo, trifluorometiltiol, C₁-C₆-alquilo y C₁-C₆-alcoxilo,

o una de sus sales, sus solvatos o los solvatos de sus sales.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque

R¹ representa un grupo de fórmula



donde

* representa el sitio de enlace con el grupo carbonilo,

R⁴ representa fenilo o heteroarilo de 5 ó 6 miembros,

donde el fenilo y el heteroarilo pueden estar sustituidos con entre 1 y 3 sustituyentes, donde los sustituyentes se seleccionan de forma mutuamente independiente del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, oxo, nitro, ciano, trifluorometilo, difluorometilo, trifluorometoxilo, difluorometoxilo, monofluorometoxilo, trifluorometiltiol, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxilo, hidroxicarbonilo, C₁-C₆-alcoxicarbonilo, amino, C₁-C₆-alquilamino, aminocarbonilo y C₁-C₆-alquilaminocarbonilo,

R² representa C₁-C₆-alquilo,

donde el alquilo puede estar sustituido con un sustituyente, donde el sustituyente se selecciona del grupo que consiste en C₃-C₆-cicloalquilo y fenilo,

donde el cicloalquilo y el fenilo pueden estar sustituidos con entre 1 y 3 sustituyentes, donde los sustituyentes se seleccionan de forma mutuamente independiente del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, oxo, nitro, ciano, trifluorometilo, difluorometilo, trifluorometoxilo, difluorometoxilo, monofluorometoxilo, trifluorometiltiol, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxilo, hidroxicarbonilo, C₁-C₆-alcoxicarbonilo, amino, C₁-C₆-alquilamino, aminocarbonilo y C₁-C₆-alquilaminocarbonilo,

R³ representa fenilo,

donde el fenilo puede estar sustituido con entre 1 y 3 sustituyentes, donde los sustituyentes se seleccionan de forma mutuamente independiente del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, trifluorometilo, difluorometilo, trifluorometoxilo, difluorometoxilo, monofluorometoxilo, trifluorometiltiol, C₁-C₆-alquilo y C₁-C₆-alcoxilo.

3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2, caracterizado porque

7



* representa el sitio de enlace con el grupo carbonilo,

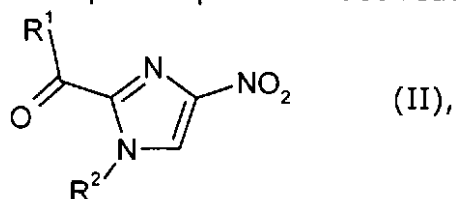
donde el fenilo y el piridilo pueden estar sustituidos con entre 1 y 3 sustituyentes, donde los sustituyentes se seleccionan de forma mutuamente independiente del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, trifluorometilo, difluorometilo, trifluorometoxilo, difluorometoxilo, monofluorometoxilo, C₁-C₄-alquilo y C₁-C₄-alcoxilo,

donde el metilo, el etilo y el n-butilo pueden estar sustituidos con un sustituyente, donde el sustituyente se selecciona del grupo que consiste en ciclopropilo y fenilo,

R³ representa fenilo,

donde el fenilo puede estar sustituido con entre 1 y 3 sustituyentes, donde los sustituyentes se seleccionan de forma mutuamente independiente del grupo que consiste en flúor, cloro, trifluorometoxilo, difluorometoxilo, trifluorometiltio y metilo.

4. Un método para preparar un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque en el primer paso se hace reaccionar un compuesto de fórmula



donde

R¹ y R² tienen el significado indicado en la reivindicación 1,

en solventes inertes seleccionados del grupo que consiste de éter dietílico, éter de metil ter-butilo, 1,2-dimetoxietano, dioxano, tetrahidrofurano, dimetil éter de glicol, dimetil éter de dietilenglicol, metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol, ter-butanol, benceno, xileno, tolueno, hexano, ciclohexano, fracciones de aceite mineral, dimetilformamida, dimetilacetamida, acetonitrilo, piridina y, en el caso de los solventes miscibles en agua, también pueden usarse mezclas de éstos con agua, con un agente reductor seleccionado del grupo que consiste de paladio sobre carbón e hidrógeno, ácido fórmico/trietilamina/paladio sobre carbón, cinc, cinc/ácido clorhídrico, hierro, hierro/ácido clorhídrico, sulfato de hierro(II)/ácido clorhídrico, sulfuro de sodio, disulfuro de sodio, ditionita de sodio, polisulfuro de amonio, borohidruro de sodio/cloruro de níquel, dicloruro de estaño, tricloruro de titanio y níquel Raney y una solución acuosa de hidrazina en un rango de temperatura de entre 0°C y la temperatura de reflujo de los solventes, a una presión entre la presión atmosférica y 3 bar, y

en el segundo paso se lo hace reaccionar en solventes inertes seleccionados del grupo que consiste de cloruro de metileno, triclorometano, tetracloruro de carbono, tricloroetano, tetracloroetano, 1,2-dicloroetano, tricloroetileno, éter dietílico, éter de metil ter-butilo, 1,2-dimetoxietano, dioxano, tetrahidrofurano, dimetil éter de glicol, dimetil éter de dietilenglicol, benceno, xileno, tolueno, hexano, ciclohexano, fracciones de aceites minerales, acetato de etilo, acetona, dimetilformamida, dimetilacetamida, 2-butanona, dimetil sulfóxido, acetonitrilo, piridina y, en el caso de los solventes miscibles con agua, también pueden usarse mezclas de éstos con agua en presencia de un derivado de ácido carbónico seleccio-

nado del grupo que consiste de N,N-carbonildiimidazol, fosgeno, difosgeno, trifosgeno, cloroformato de fenilo y cloroformato de 4-nitrofenilo, con un compuesto de fórmula H_2N-R^3 (III),

donde

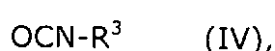
R^3 tiene el significado indicado en la reivindicación 1,

en un rango de temperatura entre la temperatura ambiente y 40°C a presión atmosférica.

5. El método para preparar un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque en el primer paso se hace reaccionar el compuesto de fórmula (II) de acuerdo con la reivindicación 4 en solventes inertes seleccionados del grupo que consiste de éter dietílico, éter de metil ter-butilo, 1,2-dimetoxietano, dioxano, tetrahidrofurano, dimetil éter de glicol, dimetil éter de dietilenglicol, metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol, ter-butanol, benceno, xileno, tolueno, hexano, ciclohexano, fracciones de aceite mineral, dimetilformamida, dimetilacetamida, acetonitrilo, piridina y, en el caso de los solventes miscibles en agua, también pueden usarse mezclas de éstos con agua,

con un agente reductor seleccionado del grupo que consiste de paladio sobre carbón e hidrógeno, ácido fórmico/trietilamina/paladio sobre carbón, cinc, cinc/ácido clorhídrico, hierro, hierro/ácido clorhídrico, sulfato de hierro(II)/ácido clorhídrico, sulfuro de sodio, disulfuro de sodio, ditionita de sodio, polisulfuro de amonio, borohidruro de sodio/cloruro de níquel, dicloruro de estaño, tricloruro de titanio y níquel Raney y una solución acuosa de hidrazina en un rango de temperatura de entre 0°C y la temperatura de reflujo de los solventes, a una presión entre la presión atmosférica y 3 bar, y

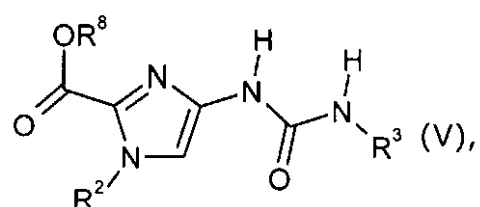
en el segundo paso se lo hace reaccionar en solventes inertes seleccionados del grupo que consiste de cloruro de metileno, triclorometano, tetracloruro de carbono, tricloroetano, tetracloroetano, 1,2-dicloroetano, tricloroetileno, éter dietílico, éter de metil ter-butilo, 1,2-dimetoxietano, dioxano, tetrahidrofurano, dimetil éter de glicol, dimetil éter de dietilenglicol, benceno, xileno, tolueno, hexano, ciclohexano, fracciones de aceites minerales, acetato de etilo, acetona, dimetilformamida, dimetilacetamida, 2-butanona, dimetil sulfóxido, acetonitrilo y piridina, con un compuesto de fórmula



donde

R^3 tiene el significado indicado en la reivindicación 1, en un rango de temperatura entre la temperatura ambiente y la temperatura de reflujo de los solventes a presión atmosférica, opcionalmente en presencia de una base seleccionada del grupo que consiste de carbonato de cesio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, terbutóxido de potasio, hidruro de sodio, DBU, trietilamina y diisopropilamina.

6. Un método para preparar un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque en el primer paso se hace reaccionar un compuesto de fórmula



donde

R^2 y R^3 tienen el significado indicado en la reivindicación 1, y R^8 representa metilo o etilo,

en solventes inertes seleccionados del grupo que consiste de cloruro de metileno, triclorometano, tetracloruro de carbono, tricloroetano, tetracloroetano, 1,2-dicloroetano, tricloroetileno, éter dietílico, éter de metil ter-butilo, 1,2-dimetoxietano, dioxano, tetrahidrofurano, dimetil éter de glicol, dimetil éter de dietilenglicol, metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol, ter-butanol, benceno, xileno, tolueno, hexano, ciclohexano, fracciones de aceites minerales, dimetilformamida, dimetilacetamida, dimetil sulfóxido, acetonitrilo, piridina y mezclas de solventes con agua, con una base seleccionada del grupo que consiste de hidróxido de sodio, hidróxido de litio, hidróxido de potasio, carbonato de cesio, carbonato de sodio y carbonato de potasio, en un rango de temperatura de entre 0°C y la temperatura de reflujo de los solventes a presión atmosférica, y en el segundo paso se lo hace reaccionar en solventes inertes seleccionados del grupo que consiste de cloruro de metileno, triclorometano, tetracloruro de carbono, tricloroetano, tetracloroetano, 1,2-dicloroetano, tricloroetileno, éter dietílico, éter de metil ter-butilo, 1,2-dimetoxietano, dioxano, tetrahidrofurano, dimetil éter de glicol, dimetil éter de dietilenglicol, benceno, xileno, tolueno, hexano, ciclohexano, fracciones de aceites minerales, acetato de etilo, acetona, dimetilformamida, dimetilacetamida, 2-butanona, dimetil sulfóxido, acetonitrilo, piridina y, en el caso de los solventes miscibles con agua, también pueden usarse mezclas de éstos con agua,

con un compuesto de fórmula

R^1-H (VI),

donde

R^1 tiene el significado indicado en la reivindicación 1,

en presencia de reactivos de deshidratación seleccionados del grupo que consiste de N,N'-dietil, N,N'-dipropil, N,N'-diisopropil-, N,N'-díciclohexilcarbodiimida, clorhidrato de N-(3-dimetilaminoisopropil)-N'-

etilcarbodiimida (EDC), N'-propiloximetil-poliestireno de N-ciclohexilcarbodiimida (PS-carbodiimida), carbonildiimidazol, 3-sulfato de 2-etil-5-fenil-1,2-oxazolio, perclorato de 2-ter-butil-5-metilisoxazolio, 2-etoxi-1-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina, anhídrido propanfosfónico, cloroformato de isobutilo, cloruro de bis(2-oxo-3-oxazolidinil)fosforilo, hexafluorofosfato de benzotriazoliloxitri (dimetil-amino)fosfonio, hexafluorofosfato de O-(benzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio (HBTU), tetrafluoroborato de 2-(2-oxo-1-(2H)-piridil)-1,1,3,3-tetrametiluronio (TPTU), hexafluorofosfato de O-(7-azabenzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio (HATU), 1-hidroxibenzotriazol (HOBt), hexafluorofosfato de benzotriazol-1-iloxitris(dimetilamino)fosfonio (BOP) y mezclas de éstos con bases, las cuales se seleccionan del grupo que consiste de carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, trietilamina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, DBU, DBN y piridina, en un rango de temperatura de entre -70°C y 40°C a presión atmosférica.

7. Un medicamento, caracterizado porque comprende un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 en combinación con al menos un excipiente inerte no tóxico farmacéuticamente aceptable, en donde dicho al menos un excipiente incluye vehículos (tales como, celulosa microcristalina, lactosa, manitol), solventes (tales como, polietilenglicoles líquidos), emulsionantes y agentes dispersantes o humectantes (tales como, dodecil sulfato de sodio, oleato de polioxisorbitan), aglutinantes (tales como, polivinilpirrolidona), polímeros sintéticos y naturales (tales como, albúmina), estabilizadores (tales como, antioxidantes, tales como, ácido ascórbico), colorantes (tales como, pigmentos inorgánicos, tales como, óxidos de hierro) y correctores del sabor y/o el aroma.