



No. 07-068704- -00003-0000

Fecha: 2011-08-01 15:53:37 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 6

As. 104.013

Señor

**DIRECTOR DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

E.

S.

D.

REF: Expediente No. **07 068 704**– solicitud de patente de invención a favor de **ASTRAZENECA AB.** Título **DERIVADOS DE OXADIAZOL COMO INHIBIDORES DE DGAT**

RESPUESTA A EXAMEN DE FONDO

JUAN PABLO CADENA SARMIENTO, portador de la tarjeta profesional No. 57.492 del C.S.J., obrando como apoderado de la sociedad solicitante me permito dar respuesta al concepto técnico numero 0919 relacionado con la patentabilidad de la presente invención y notificado por fijación en lista el 6 de mayo de 2011.

Con el ánimo de subsanar las objeciones planteadas por el señor Examinador, me permito presentar un nuevo pliego reivindicatorio de 1-9 reivindicaciones, en donde no se amplía en ningún momento la materia inicialmente divulgada y encuentra entero sustento en la descripción.

1. Claridad

En primer lugar, vale resaltar que se han eliminado todas las reivindicaciones que contienen materia no patentable, como métodos de tratamiento, y todas las reivindicaciones referentes a usos. De esta manera, todas las reivindicaciones presentadas se refieren únicamente a productos o procesos.

Ahora en cuanto al contenido de las reivindicaciones, se ha reducido considerablemente la cantidad de sustituyentes en el compuesto de fórmula (I). Específicamente, los radicales arilo, heteroarilo y cicloalquilo objetados por el señor examinador han sido eliminados. De hecho, el grupo arilo ha sido definido como fenilo en el radical R¹.

En cuanto a la expresión opcionalmente sustituidos, en el radical R¹ se establece que el fenilo se encuentra opcionalmente sustituido por 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de halo, alquilo (C₁₋₄), etinilo, alcoxi (C₁₋₄), etc, de tal manera que la expresión es clara en la reivindicación 1. De igual manera, el señor examinador podrá notar que los radicales R¹, Y y R² han sido drásticamente restringidos.

En conclusión, los grupos incluidos en las nuevas reivindicaciones se definen inequívocamente y se encuentran adecuadamente sustentados en la descripción, aportando de esta manera claridad y concisión a la presente solicitud.

Por otra parte, se ha eliminado el término “profármaco farmacéuticamente aceptable”, por lo cual consideramos subsanada dicha objeción.

La nueva reivindicación 9, referente a un proceso para preparar una de las composiciones reivindicadas, está definida por las etapas necesarias para obtener el producto y es clara por sí misma al definir correctamente todas las reacciones, con reactivos y productos implicados.

De la misma manera, las objeciones presentadas en vista de las antiguas reivindicaciones 14 y 15 han sido superadas al eliminarse dichas reivindicaciones.

2. Novedad

El nuevo pliego reivindicatorio cumple con el requisito de novedad porque revela características técnicas esenciales no enseñadas en el estado de la técnica, como se demostrará a continuación.

En relación a D1, es preciso mencionar que para llegar a la estructura reivindicada (a partir de la gran cantidad de sustituyentes mencionados en dicho documento) sería necesario que el radical P fuera un grupo fenilo como el acá reivindicado., D1 no revela específicamente un grupo fenilo opcionalmente sustituido en dicha posición. Por lo tanto, la presente invención es novedosa con relación a D1.

En vista de lo anteriormente expuesto, respetuosamente solicitamos el retiro de las objeciones de la presente solicitud y la concesión del privilegio solicitado, ya que en opinión del solicitante cumple con todos los requisitos establecidos en la decisión 486.

3. Anexos

3.1. Nuevo pliego reivindicatorio.

Del Señor Director



JUAN PABLO CADENA SARMIENTO

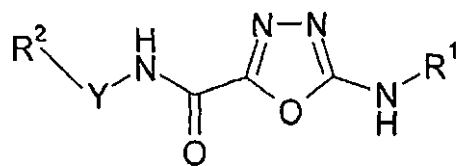
T.P. No. 57.492 del C.SJ.

C.C. 80.410.337 de Usaquén

Calle 70 A No. 4 - 41

Reivindicaciones

1. Un compuesto de fórmula (I)



(I)

o su sal farmacéuticamente aceptable, en donde:

R^1 es un fenilo sustituido opcionalmente por 1,2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de halo, alquilo (C_{1-4}), etinilo, alcoxi (C_{1-4}), hidroxí, alcoxi (C_{1-4}); metoximetil, cianometil, hidroxialquilo (C_{1-4}), trifluorometil, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluorometiltio, ciano, metiltio, metilsulfonilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, aminocarbonilamino, metoxicarbonilamino, metilcarbonilamino, alcoxycarbonilo (C_{1-4}), metoxicarbonilmetoxi, benciloxi, piridilmetoxi, fenoxi (sustituido opcionalmente por metoxi o halo), fenilo (sustituido opcionalmente por metoxicarbonilo o carboxi), bencilo, anilino, anilincarbonilo, aminocarbonilo, benzoilo, benzoilamino, fenilsulfonilo, aminosulfonilo, ciclohexilo, metilpirimidinilo, triazolilo y morfolino;

Y es un enlace directo;

R^2 es un fenilo sustituido opcionalmente, en donde los sustituyentes opcionales son un sustituyente grupo -Z, y uno o más sustituyentes adicionales seleccionados entre halo, ciano, nitro, amino, hidroxí o halo alquilo (C_{1-6});

en donde Z es un grupo hidrocarbilo sustituido opcionalmente seleccionado de alquilo (C_{1-6}), fenilo, cicloalquilo (C_{3-8}), cicloalquilo (C_{3-8}) combinado con alquilo (C_{1-4}) y fenilo combinado con alquilo (C_{1-4}).

en donde el grupo Z es sustituido opcionalmente en cualquier átomo disponible por uno o más de los grupos funcionales seleccionados de halo, haloalquilo (C_{1-6}), ciano, nitro, $-C(O)_nR^{20}$, $-OR^{20}$, $-S(O)_mR^{20}$, $-OS(O)_2R^{20}$, $-NR^{21}R^{22}$, $-C(O)NR^{21}R^{22}$, $-OC(O)NR^{21}R^{22}$, $-CH=NOR^{20}$, $-NR^{21}C(O)_nR^{20}$, $-NR^{20}CONR^{21}R^{22}$, $-N=CR^{21}R^{22}$, $-S(O)_2NR^{21}R^{22}$ o $-NR^{21}S(O)_2R^{22}$

donde R^{20} , R^{21} y R^{22} son hidrogeno, n es un entero de 1 o 2, m es 0 o un entero de 1-2.

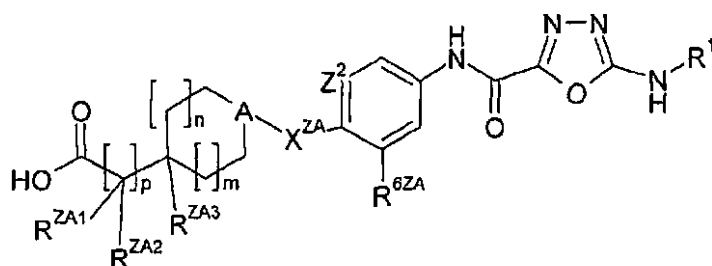
2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, o su sal farmacéuticamente aceptable, en donde los sustituyentes opcionales sobre R^1 son 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, trifluorometilo, (C_{1-4}) alquilo, trifluorometoxi y ciano.

3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, o su sal farmacéuticamente aceptable, en donde R^1 es sustituido por 2 grupos independientemente seleccionados entre halo.

4. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, o su sal farmacéuticamente aceptable,
 en donde R^2 es fenilo sustituido, en la posición *para* al enlace con el grupo $-Y-NH-$, por un grupo seleccionado entre R^4 ;
 en donde R^4 es un grupo R^{8b} donde R^{8b} está sustituido por un sustituyente R^{7b} ;
 en donde R^{8b} es cicloalquil (C_{3-8});
 en donde R^{7b} es R^{12} o R^{12} alquilo (C_{1-4}); y
 en donde R^{12} es carboxi.

5. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, o su sal farmacéuticamente aceptable,
 en donde R^2 es fenilo sustituido, en la posición *para* al enlace con el grupo $-Y-NH-$, por un grupo seleccionado entre R^4 y adicionalmente sustituido en un átomo de carbono en una posición-3 por R^{6a} ;
 en donde R^4 es un grupo R^{8b} donde R^{8b} está sustituido por un sustituyente R^{7b} ;
 en donde R^{6a} se selecciona de halo y ciano;
 en donde R^{8b} es cicloalquilo (C_{3-8});
 en donde R^{7b} es R^{12} o R^{12} alquil (C_{1-4}); y
 en donde R^{12} es carboxi.

6. Un compuesto de fórmula (I), que es un compuesto de fórmula (IZA), o su sal farmacéuticamente aceptable,



(IZA)

en donde R^1 se selecciona de fenilo (opcionalmente sustituido con 1, 2 ó 3 sustituyentes independientemente seleccionados de fluoro, cloro, trifluorometilo, trifluorometoxi, ciano, metilo y etilo;

Z^2 es CH ;

R^{ZA1} y R^{ZA2} son cada uno independientemente hidrógeno o metilo;

R^{ZA3} es hidrógeno;

R^{6ZA} es hidrógeno, fluoro, cloro o metilo;

A es CH ;

X^{ZA} es un enlace directo o $-CH_2-$;

m es 0, 1 ó 2;

n es 0 ó 1;

siempre que $m + n = 0, 1$ ó 2;

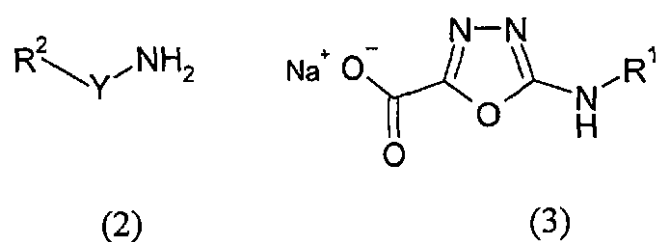
p es 0 ó 1.

7. El compuesto ácido (*trans*-4-{4-[(5-[3,4-difluorofenil)amino]-1,3,4-oxodiazol-2-il)carbonil)amino]fenil}ciclohexil)acético

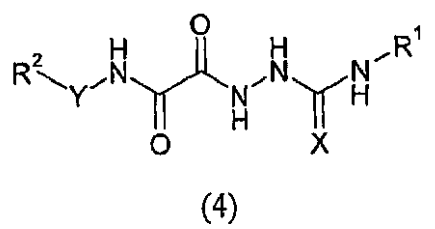
8. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de fórmula (I) como se reivindica en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7 o su sal farmacéuticamente aceptable, en asociación con un excipiente o vehículo farmacéuticamente aceptable.

9. Un proceso para preparar un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, que comprende uno de los siguientes pasos (en donde todas las variables son como se definieron anteriormente para un compuesto de fórmula (I) a menos que se indique lo contrario):

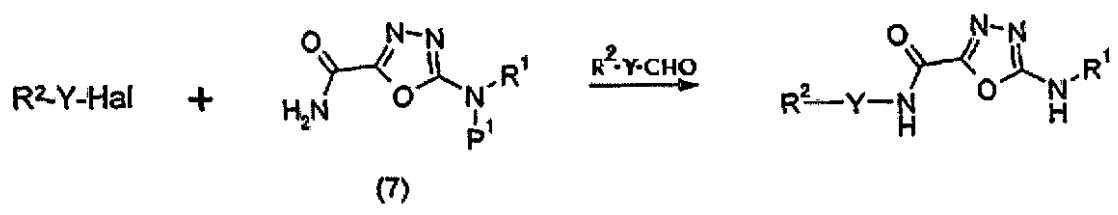
a) reacción de una amina de fórmula (2) con una sal carboxilato de fórmula (3);



b) ciclación de un compuesto de fórmula (4) (donde X es S u O);



c) reacción de R² halogenado (por ejemplo con yodo) con una amida de fórmula (7), seguida por el retiro subsiguiente del grupo protector P¹, en donde P¹ es por ejemplo bencilo o trimetilsililetoximetilo (SEM), por ejemplo;



en donde Hal es halógeno;

y, posteriormente, si es necesario, remover cualesquiera grupos protectores, y/o formando una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.