

Clarke, M.

COLC

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 08-031516- -00007-0000

Fecha: 2012-05-22 15:36:09 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 11

No. 08-031516- -00007-0000

Fecha: 2012-05-22 15:36:09 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 9

1

P-1209

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. S. D.

Re: Expediente No. 08.031.516

Solicitud de patente a nombre de **JANSSEN PHARMACEUTICA N.V.**

Yo, DILIA RODRIGUEZ D'ALEMAN, identificada como aparece al pie de mi firma, domiciliada en la carrera 11 No. 86-53, piso 6, obrando como apoderada de la sociedad **JANSSEN PHARMACEUTICA N.V.**, domiciliada en Beerse, Bélgica, solicitante de la patente de la referencia, en respuesta al oficio No. 2952 notificado por fijación en lista el 24 de febrero de 2012, me permito manifestar:

1. Con fundamento en la facultad que confiere el artículo 34 de la Decisión 486 al solicitante para modificar la solicitud de patente en cualquier momento del trámite, presento junto con este memorial un nuevo capítulo reivindicatorio el cual comprende 1 a 18 reivindicaciones y reemplaza completamente el capítulo anterior. Las reivindicaciones se corrigen para subsanar las objeciones presentadas a la claridad de la solicitud en estudio.

En cuanto a estas modificaciones, me permito decir que las mismas no amplían de ninguna manera la materia objeto de la presente solicitud y se realizaron con el ánimo de superar las objeciones de claridad, planteadas por el examinador en su concepto técnico.

2. Claridad de la solicitud

El examinador objeta la claridad de las reivindicaciones 1 – 3 y 5 – 17, argumentando que no son concisas porque los diferentes radicales se definen como géneros funcionales, sin especificar el número de carbonos, y los heterocíclicos específicos. De igual forma, el examinador requiere al solicitante delimitar la solicitud a una generalización razonable, particularmente a aquellos compuestos presentes en los ejemplos.

Al respecto, el solicitante quisiera anotar, en primer lugar, que el artículo 52 de la decisión 486 establece lo siguiente:

“Artículo 51.- El alcance de la protección conferida por la patente estará

P-1209

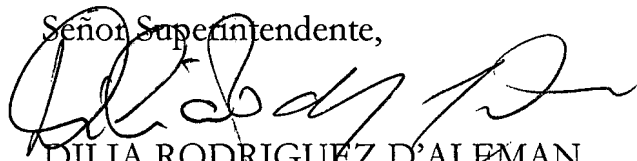
determinado por el tenor de las reivindicaciones. La descripción y los dibujos, o en su caso, el material biológico depositado, servirán para interpretarlas.” (Resaltado fuera del texto)

Como se puede observar, las páginas 18 – 24 de la descripción ofrecen definiciones específicas para cada uno de los términos objetados por el examinador. Al tenor de lo dispuesto en el citado artículo, el experto con habilidad en la materia no tendría ningún inconveniente en interpretar el significado de las definiciones dadas en el capítulo reivindicatorio para los diferentes grupos descritos.

En segundo lugar, requerirle al solicitante que limite el alcance de su invención a la materia objeto de los ejemplos no solo va en contra de lo establecido por la Decisión 486, sino que además afecta significativamente los intereses y derechos del solicitante. Por tratarse de un medicamento que aún no ha culminado su fase de pruebas clínicas, existe una gran posibilidad que los compuestos que no se encuentran contenidos en los ejemplos tengan mejor actividad farmacológica, por lo que el requerimiento de esa oficina haría virtualmente imposible la protección del objeto de la solicitud. Negando le al solicitante el derecho que tiene a proteger su invención de la forma más completa y haciendo obsoleta la posible patente que pueda ser concedida a los compuestos de los ejemplos.

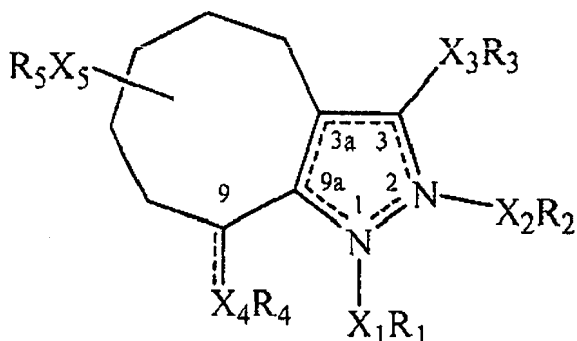
En resumen, me permito decir que gracias a las modificaciones expuestas en el punto 1 y el punto 2 de este memorial y los argumentos anteriormente mencionados, la presente solicitud cumple cabalmente con los requisitos de claridad respecto a los compuestos divulgados en el capítulo reivindicatorio modificado adjunto. Por lo tanto, solicito comedidamente a ese despacho se sirva reconocer estos requisitos y conceder el privilegio de patente de invención a la solicitud en estudio.

Señor Superintendente,


DILIA RODRIGUEZ D'ALEMAN
CC. 41.654.882 de Bogotá
TP 20824
Cód. 008

REIVINDICACIONES

1.- Un compuesto que tiene una estructura de conformidad con la fórmula (I):



o una sal del mismo en donde

las líneas punteadas entre las posiciones 2-3 y las posiciones 3a-9a en la fórmula

(I) representan las ubicaciones para cada uno de los dos enlaces dobles presentes cuando X_1R_1 está presente;

las líneas punteadas entre las posiciones 3-3a y las posiciones 9a-1 en la fórmula

(I) representan las ubicaciones para cada uno de los dos enlaces dobles presentes cuando X_2R_2 está presente;

la línea punteada entre la posición 9 y X_4R_4 en la fórmula (I) representa la ubicación para un enlace doble;

X_1 está ausente o es alquileo inferior;

X_2 está ausente o es alquileo inferior;

en donde solamente uno de X_1R_1 y X_2R_2 está presente;

X_3 está ausente, es alquileo inferior, alquilideno inferior o -NH-;

cuando la línea punteada entre la posición 9 y X_4R_4 está ausente, X_4 está ausente o es alquileo inferior;

cuando la línea punteada entre la posición 9 y X_4R_4 está presente, X_4 está ausente;

X_5 está ausente o es alquileo inferior;

R_1 se selecciona a partir de hidrógeno, alquilo (opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno, hidroxilo o alcoxi inferior), alquilo inferior-sulfonilo, arilo, cicloalquilo de C_3-C_{12} o heterociclilo, en donde arilo, cicloalquilo de C_3-C_{12} o heterociclilo está cada uno opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno, aminosulfonilo, alquilo inferior-aminosulfonilo, alquilo (opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno, hidroxilo o alcoxi inferior), hidroxilo o alcoxi (opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno o hidroxilo);

R_2 se selecciona a partir de hidrógeno, alquilo (opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno, hidroxilo o alcoxi inferior), alquilo inferior-sulfonilo, arilo, cicloalquilo de C_3-C_{12} o heterociclilo, en donde arilo, cicloalquilo de C_3-C_{12} o heterociclilo está cada uno opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno, aminosulfonilo, alquilo inferior-aminosulfonilo, alquilo (opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno, hidroxilo o alcoxi inferior), hidroxilo o alcoxi (opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno o hidroxilo);

R_3 es $-C(O)-Z_1(R_6)$, $-SO_2-NR_7-Z_2(R_8)$ o $-C(O)-NR_9-Z_3(R_{10})$;

cuando la línea punteada entre la posición 9 y X_4R_4 está ausente, X_4 está ausente o es alquilenilo inferior y R_4 es hidrógeno, hidroxilo, alquilo inferior, alcoxi inferior, halógeno, arilo, cicloalquilo de C_3-C_{12} o heterociclilo, en donde arilo, cicloalquilo de C_3-C_{12} o heterociclilo está cada uno opcionalmente sustituido en una o más posiciones por hidroxilo, oxo, alquilo inferior (opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno, hidroxilo o alcoxi inferior), alcoxi inferior (opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno o hidroxilo) o halógeno;

cuando la línea punteada entre la posición 9 y X_4R_4 está presente, X_4 está ausente y R_4 es CH-arilo o CH-heteroarilo, en donde el arilo o heterociclilo está cada

uno opcionalmente sustituido en una o más posiciones por hidroxí, oxo, alquilo inferior, alcoxi inferior o halógeno;

R₅ está ausente, es hidroxí, halógeno, amino, aminoalquilo, alquilo (opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno, hidroxí o alcoxi inferior), alcoxi (opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno o hidroxí), carboxi, carbonilalcoxi, carbamoilo, carbamoilalquilo, arilo, ariloxi, arilalcoxi o heterociclilo;

R₆ es arilo, cicloalquilo de C₃-C₁₂ o heterociclilo, en donde el arilo, cicloalquilo de C₃-C₁₂ o heterociclilo está cada uno opcionalmente sustituido por uno o más de hidroxí, oxo, halógeno, amino, aminoalquilo, alquilo (opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno, hidroxí o alcoxi inferior), alcoxi (opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno o hidroxí), carboxi, carbonilalcoxi, carbamoilo, carbamoilalquilo, arilo, ariloxi, arilalcoxi o heterociclilo;

R₇ es hidrógeno o alquilo inferior;

R₈ es arilo, cicloalquilo de C₃-C₁₂ o heterociclilo, en donde el arilo, cicloalquilo de C₃-C₁₂ o heterociclilo está cada uno opcionalmente sustituido por uno o más de hidroxí, oxo, halógeno, amino, aminoalquilo, alquilo (opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno, hidroxí o alcoxi inferior), alcoxi (opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno o hidroxí), carboxi, carbonilalcoxi, carbamoilo, carbamoilalquilo, arilo, ariloxi, arilalcoxi o heterociclilo;

R₉ es hidrógeno o alquilo inferior;

R₁₀ es arilo, cicloalquilo de C₃-C₁₂ o heterociclilo, en donde el arilo, cicloalquilo de C₃-C₁₂ o heterociclilo está cada uno opcionalmente sustituido por uno o más de hidroxí, oxo, halógeno, amino, aminoalquilo, alquilo (opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno, hidroxí o alcoxi inferior),

alcoxi (opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno o hidroxilo), carboxi, carbonilalcoxi, carbamoilo, carbamoilalquilo, aminosulfonilo, alquilo inferior-aminosulfonilo, arilo, ariloxi, arilalcoxi o heterociclilo;

Z_1 y Z_2 está cada uno ausente o es alquilo; y,

Z_3 está ausente, es $-NH-$, $-SO_2-$ o alquilo (en donde el alquilo está opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno, hidroxilo, alquilo inferior, alcoxi inferior, carboxi o carbonilalcoxi).

2.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o una sal del mismo, caracterizado además porque X_1 está ausente o es alquileo inferior; y, R_1 se selecciona a partir de hidrógeno, alquilo (opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno, hidroxilo o alcoxi inferior), arilo, cicloalquilo de C_3-C_{12} o heterociclilo, en donde arilo, cicloalquilo de C_3-C_{12} o heterociclilo está cada uno opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno, alquilo (opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno, hidroxilo o alcoxi inferior), hidroxilo o alcoxi (opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno o hidroxilo).

3.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o una sal del mismo, caracterizado además porque X_1 está ausente; y, R_1 se selecciona a partir de arilo o cicloalquilo de C_3-C_{12} , en donde arilo está opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno.

4.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o una sal del mismo, caracterizado además porque R_3 es $-C(O)-Z_1(R_6)$, $-SO_2-NH-Z_2(R_8)$ o $-C(O)-NH-Z_3(R_{10})$.

5.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o una sal del mismo, caracterizado además porque R_3 es $-C(O)-Z_1(R_6)$; X_3 está ausente, es alquileo inferior, alquilideno inferior o $-NH-$; Z_1 está ausente o es alquilo; y, R_6 es arilo, cicloalquilo de C_3-C_{12} o heterociclilo está cada uno opcionalmente sustituido por uno o más de hidroxilo, oxo, halógeno, amino, aminoalquilo, alquilo (opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno, hidroxilo o alcoxi inferior), alcoxi (opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno o hidroxilo), carboxi, carbonilalcoxi, carbamoilo, carbamoilalquilo, arilo, ariloxi, arilalcoxi o heterociclilo.

6.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o una sal del mismo, caracterizado además porque R_3 es $-C(O)-Z_1(R_6)$; X_3 está ausente; Z_1 está ausente; y, R_6 es heterociclilo.

7.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o una sal del mismo, caracterizado además porque R_3 es $-C(O)-NR_9-Z_3(R_{10})$; X_3 está ausente, es alquileo inferior, alquilideno inferior o $-NH-$; R_9 es hidrógeno o alquilo inferior; Z_3 está ausente, es $-NH-$, $-SO_2-$ o alquilo (en donde el alquilo está opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno, hidroxilo, alquilo inferior, alcoxi inferior, carboxi o carbonilalcoxi); y, R_{10} es arilo, cicloalquilo de C_3-C_{12} o heterociclilo cada uno opcionalmente sustituido por uno o más de hidroxilo, oxo, halógeno, amino, aminoalquilo, alquilo (opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno, hidroxilo o alcoxi inferior), alcoxi (opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno o hidroxilo), carboxi, carbonilalcoxi, carbamoilo, carbamoilalquilo, aminosulfonilo, alquilo inferior- aminosulfonilo, arilo, ariloxi, arilalcoxi o heterociclilo.

8.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o una sal del mismo, caracterizado además porque R_3 es $-C(O)-NH-Z_3(R_{10})$; X_3 está ausente; Z_3 está ausente, es $-NH-$ o alquilo (en donde el alquilo está opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno, hidroxilo, alquilo inferior, alcoxi inferior, carboxi o carbonilalcoxi); y, R_{10} es arilo, cicloalquilo de C_3-C_{12} o heterociclilo cada uno opcionalmente sustituido por uno o más de hidroxilo, oxo, halógeno, amino, aminoalquilo, alquilo (opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno, hidroxilo o alcoxi inferior), alcoxi, carboxi, carbonilalcoxi, arilo o heterociclilo.

9.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o una sal del mismo, caracterizado además porque R_3 es $-C(O)-NH-Z_3(R_{10})$; X_3 está ausente; Z_3 está ausente o es alquilo; y, R_{10} es cicloalquilo de C_3-C_{12} opcionalmente sustituido por uno o más de hidroxilo, oxo, halógeno, amino, aminoalquilo, alquilo (opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno, hidroxilo o alcoxi inferior), alcoxi, carboxi, carbonilalcoxi, arilo o heterociclilo.

10.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o una sal del mismo, caracterizado además porque R_3 es $-C(O)-NH-Z_3(R_{10})$; X_3 está ausente; Z_3 está ausente o es alquilo; y, R_{10} es cicloalquilo de C_3-C_{12} opcionalmente sustituido por uno o más de alquilo o carbonilalcoxi.

11.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o una sal del mismo, caracterizado además porque R_3 es $-C(O)-NH-Z_3(R_{10})$; X_3 está ausente; Z_3 está ausente, es $-NH-$ o alquilo (en donde el alquilo está

opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno, hidroxilo, alquilo inferior, alcoxi inferior, carboxi o carbonilalcoxi); y, R_{10} es arilo opcionalmente sustituido por uno o más de hidroxilo, oxo, halógeno, amino, aminoalquilo, alquilo (opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno, hidroxilo o alcoxi inferior), alcoxi, carboxi, carbonilalcoxi, arilo o heterociclilo.

12.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o una sal del mismo, caracterizado además porque R_3 es $-C(O)-NH-Z_3(R_{10})$; X_3 está ausente; Z_3 está ausente, es $-NH-$ o alquilo; y, R_{10} es arilo opcionalmente sustituido por uno o más de halógeno.

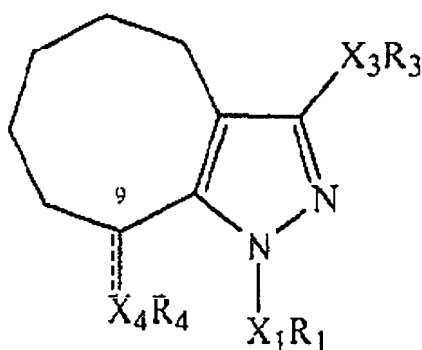
13.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o una sal del mismo, caracterizado además porque R_3 es $-C(O)-NH-Z_3(R_{10})$; X_3 está ausente; Z_3 está ausente o es alquilo (en donde el alquilo está opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno, hidroxilo, alquilo inferior, alcoxi inferior, carboxi o carbonilalcoxi); y, R_{10} es heterociclilo opcionalmente sustituido por uno o más de alquilo.

14.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o una sal del mismo, caracterizado además porque la línea punteada entre la posición 9 y X_4R_4 está ausente; X_4 está ausente; y, R_4 es hidrógeno.

15.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o una sal del mismo, caracterizado además porque la línea punteada entre la posición 9 y X_4R_4 está presente, X_4 está ausente y R_4 es CH -arilo opcionalmente sustituido en el arilo en una o más posiciones por halógeno.

16.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o una sal del mismo, caracterizado además porque X_5 está ausente y R_5 está ausente.

17.- Un compuesto de fórmula (Ia)



o una sal del mismo en donde X_1 está ausente; X_3 está ausente; cuando la línea punteada entre la posición 9 y X_4R_4 está ausente, X_4 está ausente y R_4 es hidrógeno; cuando la línea punteada entre la posición 9 y X_4R_4 está presente, X_4 está ausente y R_4 es CH-arilo, en donde el arilo está opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno; R_1 se selecciona a partir de arilo o cicloalquilo de C_3-C_{12} , en donde el arilo está opcionalmente sustituido en una o más posiciones por halógeno; R_3 es $-C(O)-Z_1(R_6)$ o $-C(O)-NH-Z_3(R_{10})$; R_6 es heterociclilo; R_{10} es arilo, cicloalquilo de C_3-C_{12} o heterociclilo, en donde el arilo o cicloalquilo de C_3-C_{12} está cada uno opcionalmente sustituido por uno o más de halógeno, alquilo o carbonilalcoxi; Z_1 está ausente; y, Z_3 está ausente, es $-NH-$ o alquilo.

18.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o una sal del mismo seleccionado a partir de:

(1,3,3-trimetil-biciclo[2.2.1]hept-2-il)-amida del ácido 1-ciclohexil-4,5,6,7,8,9-hexahidro-1H-ciclooctapirazol-3-carboxílico,

(adamantan-1-ilmetil)-amida del ácido 1-ciclohexil-4,5,6,7,8,9-hexahidro-1H-ciclooctapirazol-3-carboxílico,

(adamantan-1-ilmetil)-amida del ácido 1-ciclopentil-4,5,6,7,8,9-hexahidro-1H-ciclooctapirazol-3-carboxílico,

éster etílico del ácido 2-[(1-ciclohexil-4,5,6,7,8,9-hexahidro-1H-ciclooctapirazol-3-carbonil)-amino]-biciclo[2.2.1]heptan-2-carboxílico,

(1-adamantan-1-il-etil)-amida del ácido 1-ciclopentil-4,5,6,7,8,9-hexahidro-1H-ciclooctapirazol-3-carboxílico,

(1-adamantan-1-il-etil)-amida del ácido 1-ciclohexil-4,5,6,7,8,9-hexahidro-1H-ciclooctapirazol-3-carboxílico,

N'-(2,4-dicloro-fenil)-hidrazida del ácido (9E)-1-(2,4-dicloro-fenil)-9-(4-fluoro-benciliden)-4,5,6,7,8,9-hexahidro-1H-ciclooctapirazol-3-carboxílico,

[(1R)-1-fenil-etil]-amida del ácido (9E)-1-(2,4-dicloro-fenil)-9-(4-fluoro-benciliden)-4,5,6,7,8,9-hexahidro-1H-ciclooctapirazol-3-carboxílico,

[(1R)-1-piridin-2-il-etil]-amida del ácido (9E)-1-(2,4-dicloro-fenil)-9-(4-fluoro-benciliden)-4,5,6,7,8,9-hexahidro-1H-ciclooctapirazol-3-carboxílico,

(9E)-[1-(2,4-dicloro-fenil)-9-(4-fluoro-benciliden)-4,5,6,7,8,9-hexahidro-1H-ciclooctapirazol-3-il]-piperidin-1-il-metanona,

[(1S)-1-fenil-etil]-amida del ácido (9E)-1-(2,4-dicloro-fenil)-9-(4-fluoro-benciliden)-4,5,6,7,8,9-hexahidro-1H-ciclooctapirazol-3-carboxílico,

[(1S)-1-ciclohexil-etil]-amida del ácido (9E)-1-(2,4-dicloro-fenil)-9-(4-fluoro-benciliden)-4,5,6,7,8,9-hexahidro-1H-ciclooctapirazol-3-carboxílico,

[(1R)-1-ciclohexil-etil]-amida del ácido (9E)-1-(2,4-dicloro-fenil)-9-(4-fluoro-benciliden)-4,5,6,7,8,9-hexahidro-1H-ciclooctapirazol-3-carboxílico,

(hexahidro-ciclopenta[c]pirrol-2-il)-amida del ácido (9E)-1-(2,4-dicloro-fenil)-9-(4-fluoro-benciliden)-4,5,6,7,8,9-hexahidro-1H-ciclooctapirazol-3-carboxílico, o

piperidin-1-ilamida del ácido (9E)-1-(2,4-dicloro-fenil)-9-(4-fluoro-benciliden)-4,5,6,7,8,9-hexahidro-1H-ciclooctapirazol-3-carboxílico.