



No. 09-024346- -00002-0000

Fecha: 2009-06-23 16:36:07 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTE IYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTA REQUE Folios: 10

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

Ref.: Expediente N° 09-024.346

Solicitud de Patente de Invención Titulada: "COMPUESTOS AZABICICLICOS
COMO INHIBIDORES DE LA RECAPTACIÓN DE MONOAMINAS"

Solicitante: GLAXO GROUP LIMITED

Nuestra Ref.: P2009/0000031

RESPUESTA AL OFICIO N° 5100 NOTIFICADO
POR FIJACION EN LISTA No. 131, DE FECHA 08 MAYO DE 2009,
(EXAMEN DE FORMA)

CARLOS R. OLARTE, mayor de edad y vecino de Bogotá, identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi carácter de apoderado de la sociedad en referencia, respetuosamente me permito presentar las modificaciones hechas al Capitulo Reivindicatorio, junto con el recibo por valor de \$111.000, para cubrir la tasa correspondiente a las modificaciones hechas, para que se tenga en cuenta dentro del presente tramite, según la Resolución No. 55819 del 26 de Diciembre de 2008.

Atentamente,

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

Adjunto: Capitulo Reivindicatorio Modificado
Recibo por \$111.000 pesos

P2009/31

Expediente No. 09-024.346

Modificaciones Voluntarias

✓

ANEXO EXPLICATIVO DE LAS MODIFICACIONES

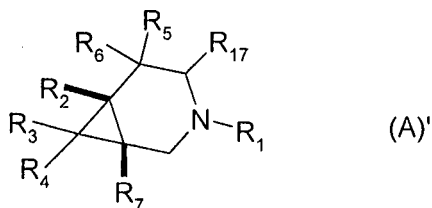
Las Reivindicaciones 9, 10 y 13-21 han sido retiradas del Capítulo Reivindicatorio.

421

3

CAPÍTULO REIVINDICATORIO MODIFICADO

1. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de fórmula (A)' o una sal farmacéuticamente aceptable, solvato o profármaco del mismo:



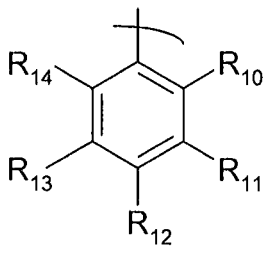
donde:

R₁ es hidrógeno o alquilo C₁₋₄;

R₂ es un grupo A, K o W

donde:

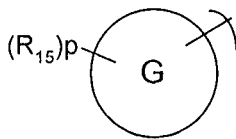
A es



K es un grupo α o β naftilo, opcionalmente sustituido con 1 ó 2 grupos R₁₈, siendo cada uno de ellos igual o diferente;

y

W es



y donde

G es un grupo heteroarilo monocíclico de 5 ó 6 miembros o un grupo heteroarilo bicíclico de 8 a 11 miembros; de tal forma que G puede estar sustituido con (R₁₅)_p, que puede ser igual o diferente;

p es un número entero entre 0 y 5;

R₃ se selecciona entre el grupo que consiste en: hidrógeno, flúor y alquilo C₁₋₄; o corresponde a un grupo X o X₁;

R₄ se selecciona entre el grupo que consiste en: hidrógeno, flúor y alquilo C₁₋₄; o corresponde a un grupo X o X₁;

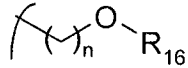
422

R₅ es hidrógeno o alquilo C₁₋₄;

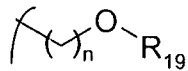
R₇ es hidrógeno o alquilo C₁₋₄; o es un grupo X, X₁, X₂ o X₃;

donde:

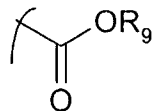
X es



X₁ es

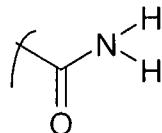


X₂ es



y

X₃ es



R₆ es hidrógeno o alquilo C₁₋₄; o es un grupo X o X₁;

R₉ es alquilo C₁₋₄;

R₁₀ se selecciona entre un grupo que consiste en: hidrógeno, halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, alcanóilo C₁₋₄ y SF₅; o corresponde a un grupo R₈;

R₈ es un grupo heterociclo de 5-6 miembros, que puede estar sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados entre un grupo que consiste en: halógeno, ciano, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄ y alcanóilo C₁₋₄;

R₁₁ se selecciona entre un grupo que consiste en: hidrógeno, halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, alcanóilo C₁₋₄ y SF₅; o corresponde a un grupo R₈;

R₁₂ se selecciona entre un grupo que consiste en: hidrógeno, halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, alcanóilo C₁₋₄ y SF₅; o corresponde a un grupo R₈;

R₁₃ se selecciona entre un grupo que consiste en: hidrógeno, halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, alcanóilo C₁₋₄ y SF₅; o corresponde a un grupo R₈;

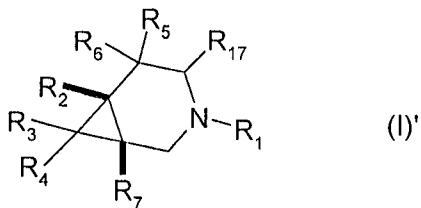
R₁₄ se selecciona entre un grupo que consiste en: hidrógeno, halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, alcanóilo C₁₋₄ y SF₅; o corresponde a un grupo R₈;

R₁₅ se selecciona entre un grupo que consiste en: halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, alcanóilo C₁₋₄ y SF₅; o corresponde a un grupo R₈;

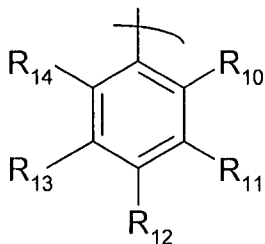
R₁₆ es hidrógeno, alquilo C₁₋₄, cicloalquilo C₃₋₆ o cicloalquil C₃₋₆-alquilo C₁₋₃;

R_{17} es hidrógeno o alquilo C_{1-4} ;
 R_{18} se selecciona entre un grupo que consiste en: halógeno, ciano, alquilo C_{1-4} ;
 R_{19} es haloalquilo C_{1-2} ;
 n es 1 ó 2;
y un vehículo farmacéuticamente aceptable.

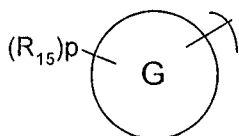
2. Un compuesto de fórmula (I)' o una sal farmacéuticamente aceptable, solvato o profármaco del mismo:



donde:
 R_1 es hidrógeno o alquilo C_{1-4} ;
 R_2 es un grupo A, K o W
donde:
A es



K es un grupo α o β naftilo, opcionalmente sustituido con 1 ó 2 grupos R_{18} , siendo cada uno de ellos igual o diferente;
y
W es



y donde
G es un grupo heteroarilo monocíclico de 5 ó 6 miembros o un grupo heteroarilo bicíclico de 8 a 11 miembros; de tal forma que G puede estar sustituido con $(R_{15})_p$, que puede ser igual o diferente;
 p es un número entero entre 0 y 5;
 R_3 se selecciona entre el grupo que consiste en: hidrógeno, flúor y alquilo C_{1-4} ; o corresponde a

124

un grupo X o X₁;

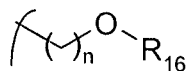
R₄ se selecciona entre el grupo que consiste en: hidrógeno, flúor y alquilo C₁₋₄; o corresponde a un grupo X o X₁;

R₅ es hidrógeno o alquilo C₁₋₄;

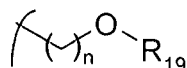
R₇ es hidrógeno o alquilo C₁₋₄; o es un grupo X, X₁, X₂ o X₃;

donde:

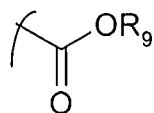
X es



X₁ es

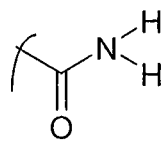


X₂ es



y

X₃ es



R₆ es hidrógeno o alquilo C₁₋₄; o es un grupo X o X₁;

R₉ es alquilo C₁₋₄;

R₁₀ se selecciona entre un grupo que consiste en: hidrógeno, halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, alcanóilo C₁₋₄ y SF₅; o corresponde a un grupo R₈;

R₈ es un grupo heterociclo de 5-6 miembros, que puede estar sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados entre un grupo que consiste en: halógeno, ciano, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄ y alcanóilo C₁₋₄;

R₁₁ se selecciona entre un grupo que consiste en: hidrógeno, halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, alcanóilo C₁₋₄ y SF₅; o corresponde a un grupo R₈;

R₁₂ se selecciona entre un grupo que consiste en: hidrógeno, halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, alcanóilo C₁₋₄ y SF₅; o corresponde a un grupo R₈;

R₁₃ se selecciona entre un grupo que consiste en: hidrógeno, halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, alcanóilo C₁₋₄ y SF₅; o corresponde a un grupo R₈;

R₁₄ se selecciona entre un grupo que consiste en: hidrógeno, halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, alcanóilo C₁₋₄ y SF₅; o corresponde a un grupo R₈;

R₁₅ se selecciona entre un grupo que consiste en: halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, alcanoilo C₁₋₄ y SF₅; o corresponde a un grupo R₈;

R₁₆ es hidrógeno, alquilo C₁₋₄, cicloalquilo C₃₋₆ o cicloalquil C₃₋₆-alquilo C₁₋₃;

R₁₇ es hidrógeno o alquilo C₁₋₄;

R₁₈ se selecciona entre un grupo que consiste en: halógeno, ciano, alquilo C₁₋₄;

R₁₉ es haloalquilo C₁₋₂;

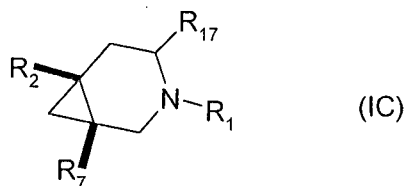
n es 1 ó 2;

con la condición de que:

si R₂ es A, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇, R₁₀, R₁₁, R₁₃ y R₁₄ son hidrógeno y R₁₂ es flúor, R₁ sea alquilo C₁₋₄;

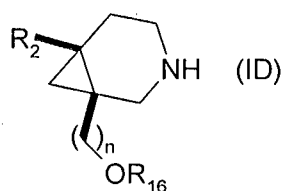
si R₂ es A, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇, R₁₀, R₁₁, R₁₃ y R₁₄ son hidrógeno y R₁ es metilo, R₁₂ sea halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, alcanoilo C₁₋₄ y SF₅; o corresponda a un grupo R₈.

3. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 2, que es un compuesto de fórmula (IC)



en la que R₁, R₂, R₇ y R₁₇ son como se han definido para los compuestos de fórmula (I)', o una sal farmacéuticamente aceptable, solvato o profármaco del mismo.

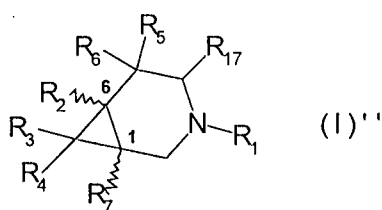
4. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 2 ó 3, que es un compuesto de fórmula (ID)



en la que R₂, R₁₆ y n son como se han definido para los compuestos de fórmula (I)', o una sal farmacéuticamente aceptable, solvato o profármaco del mismo.

5. Un compuesto de Fórmula (ID) de acuerdo con la Reivindicación 4, en el que n es 1.

6. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 2, que es un isómero estereoquímico, que tiene una configuración absoluta única en los centros estereogénicos denominados 1 y 6, de fórmula (I)''



en la que R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , R_6 , R_7 y R_{17} son como se han definido anteriormente para los compuestos de fórmula (I)', o una sal farmacéuticamente aceptable, solvato o profármaco del mismo.

7. Un compuesto de fórmula (I)', de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 2 a 6, seleccionado entre la lista que consiste en:

- (1S,6R/1R,6S)-6-(3,4-diclorofenil)-1-[(metiloxi)metil]-3-azabicyclo[4.1.0]heptano;
 - (1S,6R)-6-(3,4-diclorofenil)-1-[(metiloxi)metil]-3-azabicyclo[4.1.0]heptano;
 - (1R,6S)-6-(3,4-diclorofenil)-1-[(metiloxi)metil]-3-azabicyclo[4.1.0]heptano;
 - [(1S,6R/1R,6S)-6-(3,4-diclorofenil)-3-azabicyclo[4.1.0]hept-1-il]metanol;
 - [(1S,6R o 1R,6S)-6-(3,4-diclorofenil)-3-azabicyclo[4.1.0]hept-1-il]metanol;
 - [(1R,6S o 1S,6R)-6-(3,4-diclorofenil)-3-azabicyclo[4.1.0]hept-1-il]metanol;
 - (1R,6S/1S,6R)-6-(3,4-diclorofenil)-3-azabicyclo[4.1.0]heptano;
 - (1R,6S)-6-(3,4-diclorofenil)-3-azabicyclo[4.1.0]heptano;
 - (1S,6R)-6-(3,4-diclorofenil)-3-azabicyclo[4.1.0]heptano;
 - (1R,4S,6S/1S,4R,6R)-6-(3,4-diclorofenil)-4-metil-1-[(metiloxi)metil]-3-azabicyclo[4.1.0]heptano;
 - (1S,6R)-6-(3,4-diclorofenil)-3-metil-1-[(metiloxi)metil]-3-azabicyclo[4.1.0]heptano;
 - (1R,6S/1S,6R)-6-[4-cloro-3-(trifluorometil)fenil]-1-[(metiloxi)metil]-3-azabicyclo[4.1.0]heptano;
 - (1R,6S/1S,6R)-6-(4-clorofenil)-1-[(metiloxi)metil]-3-azabicyclo[4.1.0]heptano;
 - (1R,6S/1S,6R)-6-(3,4-diclorofenil)-1-[(etiloxi)metil]-3-azabicyclo[4.1.0]heptano;
 - (1R,6S o 1S,6R)-6-(3,4-diclorofenil)-1-[(etiloxi)metil]-3-azabicyclo[4.1.0]heptano;
 - (1S,6R o 1R,6S)-6-(3,4-diclorofenil)-1-[(etiloxi)metil]-3-azabicyclo[4.1.0]heptano;
 - (1S,6R/1R,6S)-1-[(metiloxi)metil]-6-[4-[(trifluorometil)oxi]fenil]-3-azabicyclo[4.1.0]heptano;
 - (1S,6R/1R,6S)-6-[3-cloro-4-(trifluorometil)fenil]-1-[(metiloxi)metil]-3-azabicyclo[4.1.0]heptano;
 - (1R,6S/1S,6R)-1-[(metiloxi)metil]-6-(2-naftalenil)-3-azabicyclo[4.1.0]heptano;
 - (1R,6S o 1S,6R)-1-[(metiloxi)metil]-6-(2-naftalenil)-3-azabicyclo[4.1.0]heptano;
 - (1S,6R o 1R,6S)-1-[(metiloxi)metil]-6-(2-naftalenil)-3-azabicyclo[4.1.0]heptano;
 - (1S,6R/1R,6S)-6-(3-cloro-4-fluorofenil)-1-[(metiloxi)metil]-3-azabicyclo[4.1.0]heptano;
 - (1R,6S/1S,6R)-6-(3,4-diclorofenil)-1-[(2,2,2-trifluoroetil)oxi]metil]-3-azabicyclo[4.1.0]heptano;
 - (1S,6R,7R/1R,6S,7S)-6-(3,4-diclorofenil)-7-[(metiloxi)metil]-3-azabicyclo[4.1.0]heptano;
- y una sal farmacéuticamente aceptable, solvato o profármaco del mismo:

8. Un compuesto de fórmula (I)', de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 2 a 7, que se selecciona entre la lista que consiste en:

(1S,6R)-6-(3,4-diclorofenil)-1-[(metiloxi)metil]-3-azabicyclo[4.1.0]heptano;
y una sal farmacéuticamente aceptable, solvato o profármaco del mismo.

A

9. Uso de un compuesto de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 2-8 en la preparación de un medicamento para el tratamiento de una afección en un mamífero para la que es beneficiosa la inhibición de serotonina (5-HT), dopamina (DA) y norepinefrina (NE).
10. Uso de acuerdo con la Reivindicación 9, en el que la afección a tratar es depresión.
11. Uso de acuerdo con la Reivindicación 9, en el que la afección a tratar es obesidad.
12. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 2-8 o una sal farmacéuticamente aceptable, solvato o profármaco del mismo y un vehículo farmacéuticamente aceptable.

A28

10

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 44,596
FECHA : JUNIO 16 DE 2009

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
OLARTE RAISBEK	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	105600155	16/06/2009	6,975,000.00

***** C O N C E P T O *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LEMAS COMERCIALES	111,000.00
		TOTAL :	\$ 111,000.00

SON: CIENTO ONCE MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

2129



2020
Bogotá D.C.,

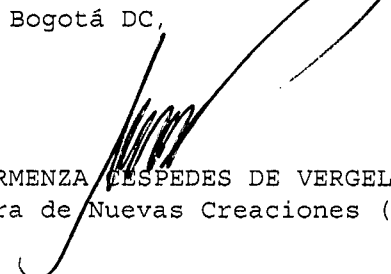
Doctor(a)
OLARTE GARCIA CARLOS REYNALDO
Apoderado(a) y/o Representante de
GLAXO GROUP LIMITED

REFERENCIA	Radicación No.	9 24346
	Solicitud internacional	PCT/EP2007/059381
	Fecha inicio fase nacional	11/04/2009
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	416
	Oficio No.	9901
	Folios	1

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, el Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), el Reglamento y la Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de Comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial.

Cúmplase
Dado en Bogotá DC,

11 FEB. 2010


ALIX CARMENZA ESPEDES DE VERGEL
Directora de Nuevas Creaciones (c)

jfernand