

NO ESTA INTER

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-077326- -00004-0000

Fecha: 2009-11-25 16:34:35 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 11

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

Ref: Expediente N°. 09-077.326

Solicitud de Patente de Invención "DERIVADOS DE 3-CINOLINA
CARBOXAMIDA Y SU USO PARA TRATAR EL CANCER"

Solicitante: ASTRAZENECA AB

Nuestra Re: P2009/000132

RESPUESTA AL OFICIO N° 10786 NOTIFICADO

POR FIJACION EN LISTA No. 288, DE FECHA 25 DE SEPTIEMBRE DE 2009,

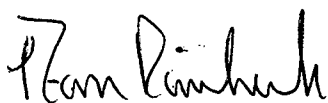
(EXAMEN DE FORMA)

J. IAN RAISBECK, 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, me permito dar respuesta al auto emanado de 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 nuevo Capitulo Reivindicatorio Modificado en donde han sido eliminadas las Reivindicaciones 2-4, 9-13 y 17-19. Se agregaron las nuevas Reivindicaciones 2-7, 11 y 15 respectivamente, para tal efecto adjunto la tasa correspondiente a dicha modificación.

2. Solicito al Despacho sea tenido en cuenta el nuevo pliego de Reivindicaciones en el presente trámite.

Atentamente,



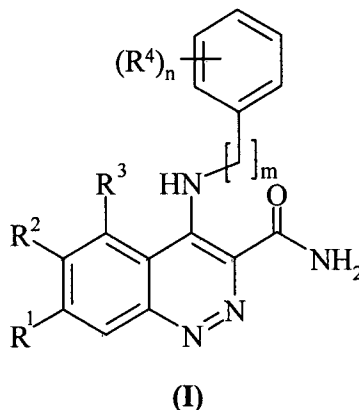
J. IAN RAISBECK
C.C. N°. 79.376.996 de Bogotá
T.P. 135.799

Anexo: Capitulo Reivindicatorio Modificado
Tasa de Modificación (\$111.000)

3

CAPITULO REIVINDICATORIO MODIFICADO
(Modificaciones Voluntarias)

1. Un compuesto de formula (I):



donde:

R¹ y R² se seleccionan independientemente entre are independently selected from hidrógeno, halo, nitro, ciano, hidroxí, trifluorometoxi, amino, carboxi, carbamoil, mercapto, sulfamoilo, alquiloC₁₋₆, alquenoilC₂₋₆, alquinoilC₂₋₆, alcoxiC₁₋₆, alcanoilC₁₋₆, alcanoiloxyc₁₋₆, N-(alquiloC₁₋₆)amino, N,N-(alquiloC₁₋₆)₂amino, N-(alquiloC₁₋₆)-N-(alcoxiC₁₋₆)amino, alcanoil(C₁₋₆)amino, N-(alquiloC₁₋₆)carbamoil, N,N-(alquiloC₁₋₆)₂carbamoil, alcoxi(C₁₋₆)carbonilo, N-(alquiloC₁₋₆)sulfamoil, N,N-(alquiloC₁₋₆)₂sulfamoil, alquilo(C₁₋₆)sulfonilamino, carbocicilil o heterocicililo; donde R¹ y R² independientemente el uno del otro, pueden estar opcionalmente sustituidos en el carbono con uno o más R⁵; y donde si dicho heterocicililo contiene una fracción -NH- ese nitrógeno puede estar opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado de R⁶;

R³ es hidrógeno o halo;

m es 0 o 1;

R⁴ se selecciona entre halo, nitro, ciano, hidroxí, trifluorometoxi, trifluorometil, amino, carboxi, carbamoilo, mercapto, sulfamoilo, alquiloC₁₋₄, alquenoilC₂₋₄, alquinoilC₂₋₄, metoxi, etoxi, acetilo, acetoxi, metilamino, etilamino, dimetilamino, dietilamino, N-metil-N-etilamino, acetilamino, N-metilcarbamoilo, N-etilcarbamoilo, N,N-dimetilcarbamoilo, N,N-dietilcarbamoilo, N-metil-N-etilcarbamoil, fenilo, metiltio, etiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, mesilo, etilsulfonilo, metoxicarbonil, etoxicarbonilo,

22a

4

N-metilsulfamoilo, N-etilsulfamoilo, N,N-dimetilsulfamoilo, N,N-dietilsulfamoilo o N-metil-N-etilsulfamoil;

o donde si dos grupos R^4 están en carbonos adyacentes, pueden formar opcionalmente un anillo carbocíclico o un anillo heterocíclico; donde dicho anillo carbocíclico o heterocíclico puede estar opcionalmente sustituido en el carbono con uno o más R^7 ; y donde si dicho anillo heterocíclico contiene una fracción $-NH-$ ese nitrógeno puede estar opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado de R^8 ;

n es 0-5; donde los valores de R^4 son iguales o diferentes;

R^5 se selecciona entre halo, nitro, ciano, hidroxil, trifluorometoxil, amino, carboxil, carbamoilo, mercapto, sulfamoilo, alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , alcoxi C_{1-6} , alcanoilo C_{1-6} , alcanoil(C_{1-6})oxil, N-(alquil C_{1-6})amino, N,N-(alquil C_{1-6}) $_2$ amino, N-(alquil C_{1-6})-N-(alcoxi C_{1-6})amino, alcanoil(C_{1-6})amino, N-(alquil C_{1-6})carbamoilo, N,N-(alquilo C_{1-6}) $_2$ carbamoilo, alquil(C_{1-6})S(O) $_a$ donde a es 0 a 2, alcoxi(C_{1-6})carbonil, alcoxi(C_{1-6})carbonilamino, N-(alquil C_{1-6})sulfamoilo, N,N-(alquil C_{1-6}) $_2$ sulfamoilo, alquil(C_{1-6})sulfonilamino, carbocicilil- R^9 - o heterocicilil- R^{10} -; donde R^5 puede estar opcionalmente sustituido en el carbono con uno o más R^{11} ; y donde si dicho heterocicililo contiene una fracción $-NH-$ ese nitrógeno puede estar opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado de R^{12} ;

R^6 y R^{12} se seleccionan independientemente entre alquilo C_{1-6} , alcanoilo C_{1-6} , alquil(C_{1-6})sulfonil, alcoxi(C_{1-6})carbonil, carbamoilo, N-(alquil C_{1-6})carbamoilo, N,N-(alquil C_{1-6})carbamoilo, bencilo, benciloxicarbonil, benzoilo y fenilsulfonilo; donde R^6 y R^{12} independientemente el uno del otro, pueden estar opcionalmente sustituidos en el carbono con uno o más R^{13} ;

R^{13} se selecciona entre halo, nitro, ciano, hidroxil, trifluorometoxil, amino, carboxil, carbamoilo, mercapto, sulfamoilo, alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , alcoxi C_{1-6} , alcanoilo C_{1-6} , alcanoil(C_{1-6})oxil, N-(alquil C_{1-6})amino, N,N-(alquil C_{1-6}) $_2$ amino, N-(alquil C_{1-6})-N-(alcoxi C_{1-6})amino, alcanoil(C_{1-6})amino, N-(alquil C_{1-6})carbamoilo, N,N-(alquilo C_{1-6}) $_2$ carbamoilo, alquil(C_{1-6})S(O) $_a$ donde a es 0 a 2, alcoxi(C_{1-6})carbonil, alcoxi(C_{1-6})carbonilamino, N-(alquil C_{1-6})sulfamoilo, N,N-(alquil C_{1-6}) $_2$ sulfamoilo, alquil(C_{1-6})sulfonilamino, carbocicilil- R^{14} - o heterocicilil- R^{15} -; donde R^{13} puede estar opcionalmente sustituido en el carbono con uno o más R^{16} ; y donde si dicho heterocicililo contiene una fracción $-NH-$ ese nitrógeno puede estar opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado de R^{17} ;

130

R^9 , R^{10} , R^{14} y R^{15} se seleccionan independientemente de un enlace directo, -O-, -N(R^{18})-, -C(O)-, -N(R^{19})C(O)-, -C(O)N(R^{20})-, -S(O)_s-, -SO₂N(R^{21})- o -N(R^{22})SO₂-; donde R^{18} , R^{19} , R^{20} , R^{21} y R^{22} se seleccionan independientemente entre hidrógeno o alquilo C₁₋₆ and s es 0-2;

R^8 y R^{17} se seleccionan independientemente entre alquiloC₁₋₆, alcaniloC₁₋₆, alquil(C₁₋₆)sulfonil, alcoxi(C₁₋₆)carbonilo, carbamoilo, N-(alquilC₁₋₆)carbamoilo, N,N-(alquilC₁₋₆)carbamoilo, bencilo, benciloxycarbonilo, benzoilo y fenilsulfonilo;

R^7 , R^{11} y R^{16} se seleccionan independientemente entre halo, nitro, ciano, hidroxilo, trifluorometoxi, trifluorometilo, amino, carboxi, carbamoilo, mercapto, sulfamoilo, alquiloC₁₋₆, alquenoC₂₋₆, alquinoC₂₋₆, metoxi, etoxi, acetilo, acetoxi, metilamino, etilamino, dimetilamino, dietilamino, N-metil-N-etilamino, acetilamino, N-metilcarbamoilo, N-etilcarbamoilo, N,N-dimetilcarbamoilo, N,N-dietilcarbamoilo, N-metil-N-etilcarbamoil, fenilo, metiltio, etiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, mesilo, etilsulfonilo, metoxycarbonil, etoxycarbonilo, N-metilsulfamoilo, N-etilsulfamoilo, N,N-dimetilsulfamoilo, N,N-dietilsulfamoilo o N-metil-N-etilsulfamoil

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

2. Un compuesto de formula (I) como se reivindicó en la Reivindicación 1 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo en donde R^1 es 2-metoxietoxi, etoxi o metoxi.

3. Un compuesto de formula (I) como se reivindicó en la Reivindicación 1 o 2 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo donde R^3 es hidrógeno.

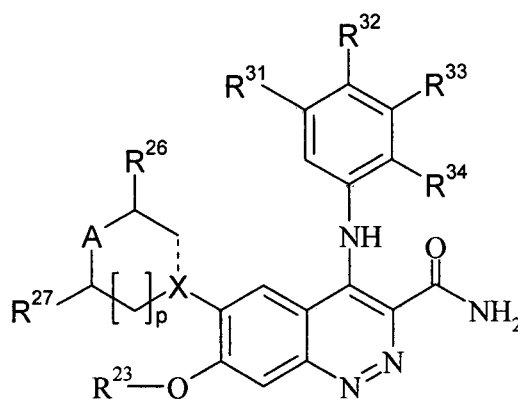
4. Un compuesto de formula (I) según cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo donde m es 0.

5. Un compuesto de formula (I) como se reivindicó en cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 4 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo donde R^4 se selecciona entre flúor, cloro o metilo.

6. Un compuesto de formula (I) como se reivindicó en cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 5 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo donde n es 2; donde los valores de R⁴ son los mismos o diferentes.

7. Un compuesto de formula (I) como se reivindicó en cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 6 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo donde R⁴, n y el fenilo al que están unidos forman 2,3-diclorofenilo, 2,4-difluorofenilo, 2-fluoro-4-metil-fenilo, 2-fluoro-5-metil-fenilo o 3-cloro-2-fluoro-fenilo.

8. Un compuesto de formula (ID):



(ID)

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, donde:

--- se selecciona entre un enlace simple y un enlace doble;

si --- es un enlace simple, entonces X se selecciona entre CH y N;

si --- es un doble enlace, entonces X es C;

A se selecciona entre O, NR²⁵, y CHR²⁹;

p es 0-2;

R²³ se selecciona entre metilo y etilo;

R²⁵ se selecciona entre hidrógeno, metilo, etilo, isopropilo, tert-butilo, 1-metoxi-2-etilo, 1-hidroxi-2-etilo, 1,1,1-trifluoro-2-etil, 2-hidroxi-1-propionilo, y mesilo;

R²⁶ y R²⁷ se seleccionan cada uno, independientemente de hidrógeno y metilo;

R²⁹ puede ser dimetilamino;

R³¹ se selecciona entre hidrógeno y metilo;

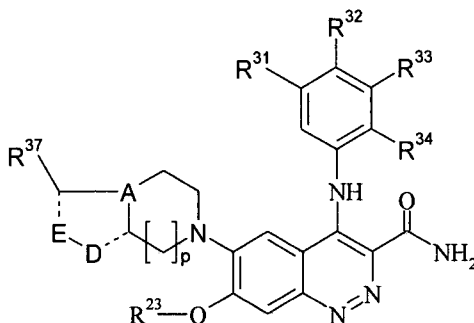
R³² se selecciona entre hidrógeno, flúor, y metilo;

R³³ se selecciona entre hidrógeno y cloro; y



R^{34} se selecciona entre flúor y cloro.

9. Un compuesto de fórmula (IE):



Fórmula (IE)

o una de sus sales farmacéuticamente aceptables, donde:

--- se selecciona entre un enlace simple y un enlace doble;

A se selecciona entre N y CH;

D se selecciona entre N, NH, CH y CH₃;

E se selecciona entre N, NH, CH y CH₂;

p es 0-1

R^{23} se selecciona de alquiloC₁₋₆;

R^{31} se selecciona de hidrógeno y alquilo C₁₋₄;

R^{32} se selecciona de hidrógeno, halo y alquilo C₁₋₄;

R^{34} es halo; y

R^{37} se selecciona entre H y OH.

10. Un compuesto de formula (I) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, seleccionado entre:

7-etoxi-4-[(2-fluoro-4-metil-fenil)amino]-6-(4-metilpiperazin-1-il)cinolina-3-carboxamida;

4-(2-fluoro-4-metilfeniloamino)-7-metoxi-6-(4-metilpiperazin-1-il)cinolina-3-carboxamida;

4-[(2,4-difluorofenil)amino]-7-metoxi-6-(4-metilpiperazin-1-il)cinolina-3-carboxamida;

6-[(3R,5S)-3,5-dimetilpiperazin-1-il]-4-[(2-fluoro-4-metilfenil)amino]-7-metoxycinolina-3-carboxamida;

8

4-[(2-fluoro-4-metilfenil)amino]-6-[4-(2-hidroxietyl)piperazin-1-il]-7-metoxicinolina-3-carboxamida;

7-etoxi-4-[(2-fluoro-4-metilfenil)amino]-6-[4-(2-hidroxietyl)piperazin-1-il]cinolina-3-carboxamida;

4-[(3-cloro-2-fluorofenil)amino]-6-[(3R,5S)-3,5-dimetilpiperazin-1-il]-7-metoxicinolina-3-carboxamida;

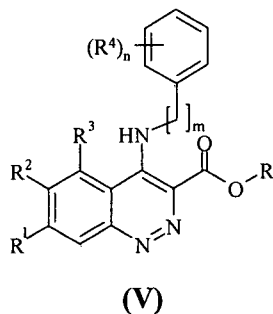
Clorhidrato de 4-[(2-fluoro-4-metilfenil)amino]-6-(1-isopropilpiperidin-4-il)-7-metoxicinolina-3-carboxamida;

4-[(2-fluoro-4-metilfenil)amino]-6-[1-(2-hidroxietyl)piperidin-4-il]-7-metoxicinolina-3-carboxamida; y

4-[(2-fluoro-4-metilfenil)amino]-6-{4-[(2R)-2-hidroxiopropanoil]piperazin-1-il}-7-metoxicinolina-3-carboxamida.

11. Un compuesto de fórmula (I) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, como se ha reivindicado en la Reivindicación 1 que es 4-[(2-fluoro-4-metilfenil)amino]-6-[4-(2-hidroxietyl)piperazin-1-il]-7-metoxicinolina-3-carboxamida.

12. Un proceso para producir un compuesto de fórmula (I), o una de sus sales farmacéuticamente aceptables, como los de las Reivindicaciones 1-11, que comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula (V):



Donde R es alquilo C1-6 con formamida y una base, de modo que se forme un compuesto de fórmula (I);

y opcionalmente después:

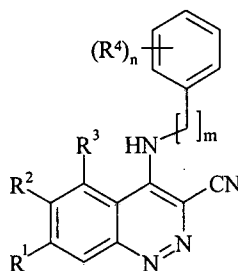
- i convertir un compuesto de fórmula (I) en otro compuesto de fórmula (I);
- ii eliminar todos los grupos protectores; o
- iii formar una sal farmacéuticamente aceptable.

234

9

13. El proceso de la Reivindicación 12, donde R se selecciona entre metilo y etilo.

14. Un proceso para producir un compuesto de fórmula (I), o una de sus sales farmacéuticamente aceptables, como los de las Reivindicaciones 1-11, que comprende hidrólisis de un compuesto de fórmula (VI):



(VI)

de modo que se forme un compuesto de fórmula (I);

y opcionalmente después:

- i convertir un compuesto de fórmula (I) en otro compuesto de fórmula (I)
- ii eliminar todos los grupos protectores; o
- iii formar una sal farmacéuticamente aceptable.

15. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de fórmula (I), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, como se ha reivindicado en cualquiera de las Reivindicaciones 1-11, en asociación con un diluyente o vehículo farmacéuticamente aceptable.

235

10

ANEXO EXPLICATIVO DE LAS REIVINDICACIONES

Se eliminaron las reivindicaciones 2-4, 9-13 y 17-19.

Se agregaron las nuevas Reivindicaciones 2-7, 11 y 15.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 87,685

FECHA : NOVIEMBRE 23 DE 2009

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-077326-00004-0000

Fecha: 2009-11-25 16:34:35 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 11

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
OLARTE RAISBEK	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	130533616	23/11/2009	4,446,000.00

***** CONCEPTO *****

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

SON: CIENTO ONCE MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____



2020
Bogotá D.C.,

Doctor(a)
RAISBECK J. IAN
Apoderado(a) y/o Representante de
ASTRAZENECA AB

REFERENCIA	Radicación No.	9 77326
	Solicitud internacional	PCT/GB2008/000256
	Fecha inicio fase nacional	25/08/2009
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	416
	Oficio No.	10754
	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,

30 JUN. 2010

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

jfernand