

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 15-308203- 00003-0000

Fecha: 2016-03-16 16:37:26 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 12

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. S. D.

Trámite: 11
Evento: 378
Actuación: 444

A-S

Re: PI.-F. HOFFMANN-LA ROCHE AG.-Solicitud de Patente de Invención en Fase Nacional PCT para "NUEVOS DERIVADOS DE TRIAZOLO[4,5-D]PIRIMIDINA".-Clase C07D 487/04.-Expediente número 15-308.203.-

1. Me refiero al auto dictado por ese Despacho mediante notificación por fijación en lista de Enero 26, 2016.
2. Con el fin de dar respuesta al Oficio No. **333** emitido por la Dirección de Nuevas Creaciones, a continuación me permito presentar los siguientes comentarios en relación con los requerimientos y objeciones formulados por ese Despacho:
3. **RESUMEN.**

Con respecto al resumen de la solicitud, el señor Examinador señala que este no muestra la información suficiente para precisar el objeto de la invención, sus elementos característicos y el campo de aplicación.

En este sentido me permito manifestar que en la Guía para Examen de Solicitudes de Patente de Invención y Modelo de Utilidad en su numeral 1.12 se establece lo siguiente:

"El examinador debe verificar que el resumen indique de manera concisa la divulgación de la técnica, el campo técnico al cual pertenece la invención, de manera que permita comprender rápidamente el problema técnico y revisar su correspondencia con la descripción, reivindicaciones y dibujos presentados originalmente, de suerte que se constituya en un instrumento indispensable y eficaz para la búsqueda de antecedentes."

Ahora bien, teniendo en cuenta lo anteriormente señalado, me permito indicar que el resumen de la solicitud es claro al reclamar compuestos derivados de triazolo[4,5-d]pirimidina, los cuales pueden ser utilizados como un medicamento.

Así pues, solicito que la objeción a este respecto sea retirada.

4. **PAGO DE TASAS.**

El señor Examinador señala la necesidad de que se pague la tasa establecida por cada reivindicación adicional presentada.

En respuesta a lo anterior, inicialmente me permito manifestar que el solicitante ha decidido disminuir el número de reivindicaciones presentadas originalmente, razón por la cual el nuevo capítulo reivindicatorio que se presenta junto con el presente memorial está compuesto por 13 reivindicaciones.

Ahora bien, con base en lo anterior atentamente manifestado a ese Despacho que adjunto al presente memorial se allega el recibo de pago expedido por esa Superintendencia y que acredita el pago de la tasa adicional por las reivindicaciones 11 a 13.

5. **REIVINDICACIONES.**

5.1. **Modificaciones al Capítulo Reivindicatorio.**

Me permito manifestar que es deseo del solicitante presentar un **capítulo reivindicatorio modificado**, que reemplaza al originalmente presentado, con el propósito de superar las objeciones presentadas por ese Despacho.

En conexión con el mencionado **capítulo reivindicatorio modificado**, me permito resaltar que éste no constituye de ninguna manera una ampliación al alcance de la solicitud tal como fue originalmente presentada, toda vez que define claramente el objeto de la presente invención de acuerdo con las enseñanzas del capítulo descriptivo. Dichas modificaciones se exponen a continuación:

- ✓ **Nueva reivindicación 1:** Corresponde a la reivindicación 1 originalmente presentada, en donde se ha especificado a que corresponden los términos haloalquilo, cicloalquilo, alquenoilo y alquilo.
- ✓ **Nuevas reivindicaciones 2 a 12:** corresponden respectivamente a las reivindicaciones 2 a 12 originalmente presentadas.
- ✓ **Nueva reivindicación 13:** Corresponde a la reivindicación 14 originalmente presentada.

De acuerdo a lo anterior, me permito aclarar que las reivindicaciones **13 y 15 a 19 han sido eliminadas** del nuevo capítulo reivindicatorio. Además, el orden de enumeración y dependencia de las nuevas reivindicaciones se ha reajustado de conformidad con las modificaciones previamente descritas.

De esta forma, **el capítulo reivindicatorio modificado queda constituido por 13 reivindicaciones**, las cuales se refieren de manera más clara y concisa a las características técnicas esenciales del objeto de la presente solicitud, y que cuenta con pleno sustento en las enseñanzas de la descripción.

5.2. Claridad y concisión del Capítulo Reivindicatorio.

Frente a las objeciones de claridad y concisión planteadas por ese Despacho, el señor Examinador aduce lo siguiente:

✓ *"El capítulo reivindicatorio no es claro porque los términos haloalquilo, cicloalquilo, alquenilo y alquilo a los que no se les define el tipo y número de átomos que los componen conlleva a un número indefinido de compuestos lo cual no permite definir claramente cuál es el objeto que se busca proteger. Se requiere realizar una razonable generalización de los compuestos reclamados de acuerdo a la materia sustentada en la descripción."*

Frente al anterior señalamiento, me permito mencionar que tal y como se menciona en el numeral 5.1 del presente memorial, dichos términos objetados han sido definidos en la nueva reivindicación 1 para mejorar el entendimiento de la misma. Así pues, teniendo en cuenta lo anteriormente señalado se tiene que dichos compuestos se refieren a:

"Alquilo", solo o en combinación, significa un grupo alquilo de cadena lineal o de cadena ramificada con 1 a 8 átomos de carbono;

"Haloalquilo", solo o en combinación, significa un grupo alquilo sustituido con uno a cinco halógenos;

"Cicloalquilo", solo o en combinación, significa un anillo cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; y

"Alquenilo", solo o en combinación, significa un residuo de hidrocarburo ramificado o de cadena lineal que comprende un enlace olefínico y hasta 8 átomos de carbono".

Por lo tanto, solicito amablemente que dicha objeción sea retirada.

✓ *"No obstante, este examen se hace a las 10 reivindicaciones canceladas, se observa que en las reivindicaciones no canceladas también se incluye materia que no es objeto de patentabilidad de acuerdo a los artículos 14 y 20, tal como métodos de tratamiento y usos."*

Con respecto a lo anterior, me permito destacar que, en virtud de las modificaciones al capítulo reivindicatorio expuestas en el numeral 5.1 del presente memorial, cualquier referencia a materia no patentable ha sido eliminada del capítulo reivindicatorio modificado.

Así pues, solicito amablemente que dicha objeción sea retirada.

Finalmente, me permito resaltar que el nuevo capítulo reivindicatorio es totalmente claro y conciso al reclamar los novedosos compuestos derivados de triazolo[4,5-d]pirimidina. Asimismo, dicho capítulo modificado supera completamente las objeciones de claridad presentadas por el Señor Examinador y, por lo tanto, cumple a cabalidad con lo estipulado por el Artículo 30 de la Decisión Andina 486 de 2000.

6. Anexo al presente memorial, me permito presentar los siguientes documentos:

- i) Recibo número 16-0025700 expedido por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago por las reivindicaciones **11 a 13**;
- ii) Copia de las páginas **80 a 88** que corresponden al nuevo capítulo reivindicatorio, el cual está conformado por **13 reivindicaciones** y que reemplaza al documento presentado originalmente ante ese Despacho.

7. Ruego a usted tomar atenta nota de lo anterior y proceder de conformidad.

8. Mi dirección es Calle 72 No. 5-83, Piso 6º, Bogotá D.C., Colombia.

Señor Superintendente,

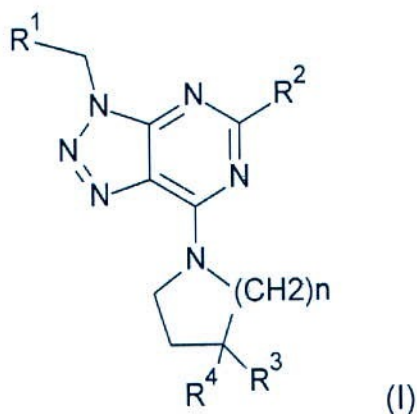


ALICIA LLOREDA RICAURTE

T. P. 53.215

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la fórmula (I):



en la que:

R^1 es haloalquilo, halofenilo, alcoxifenilo, alquil-1,2,5-oxadiazolilo, haloalquilfenilo, alquilsulfonilfenilo, halo-piridinilo o alquiltetrazolilo;

R^2 es cicloalquilo, isopropilo, alquenilo, piperidinilo, alquilamino, azetidino, pirrolidinilo, cicloalquilamino, alquioxetanilamino, morfolinilo,

(cicloalquil)(alquil)amino, haloalquiloxi, alcoxi, cicloalquilalcoxi, cicloalquiloxi, oxetaniloxi, alquioxetanilalquiloxi, alquiniloxi, alcoxi-alcoxi, hidroxialquiloxi, alquilsulfanilo, haloalquil-sulfanilo, alquilsulfonilo, hidroxialquilsulfanilo, hidroxialquilsulfonilo o alcoxialquilsulfonilo;

R^3 y R^4 se eligen con independencia entre hidrógeno, halógeno, hidroxilo, alquilcarbonilamino y alquilo, con la condición de que R^3 y R^4 no sean ambos hidrógeno al mismo tiempo; y

n es el número 1 ó 2;

o una sal o éster farmacéuticamente aceptable del mismo;

con la condición de que se excluya el (S)-1-[3-(4-metoxi-bencil)-5-(2,2,2-trifluoroetoxi)-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]-pirrolidin-3-ol.

"en donde

"Alquilo", solo o en combinación, significa un grupo alquilo de cadena lineal o de cadena ramificada con 1 a 8 átomos de carbono;

"Haloalquilo", solo o en combinación, significa un grupo alquilo sustituido con uno a cinco halógenos;

"Cicloalquilo", solo o en combinación, significa un anillo cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; y

"Alquenilo", solo o en combinación, significa un residuo de hidrocarburo ramificado o de cadena lineal que comprende un enlace olefínico y hasta 8 átomos de carbono".

2. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que R^1 es halofenilo, haloalquilfenilo o alquilsulfonilfenilo.
3. Un compuesto según la reivindicación 1 ó 2, en el que R^1 es clorofenilo, trifluormetilfenilo o metilsulfonil-fenilo.
4. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones de 1 a 3, en el que R^2 es cicloalquilo, isopropilo, alquilamino, alcoxi, haloalquiloxi o alquil-sulfanilo.
5. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones de 1 a 4, en el que R^2 es ciclobutilo, isopropilo, tert-butilamino, pentiloxi, isopropiloxi, trifluoretiloxi, trifluorpropiloxi, etilsulfanilo o tert-butilsulfanilo.
6. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones de 1 a 5, en el que R^3 y R^4 se eligen con independencia entre hidrógeno, halógeno e hidroxilo.
7. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones de 1 a 6, en el que uno de R^3 y R^4 es hidrógeno y el otro es hidroxilo, o en el que R^3 y R^4 son ambos halógeno al mismo tiempo.
8. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones de 1 a 7, en el que uno de R^3 y R^4 es hidrógeno y el otro es hidroxilo, o en el que R^3 y R^4 son ambos flúor al mismo tiempo.
9. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones de 1 a 8, elegido entre:
 - 3-[(2-clorofenil)metil]-5-ciclobutil-7-(3,3-difluor-pirrolidin-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidina;
 - 5-ciclopropil-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-3-[(4-metoxi-fenil)metil]triazolo[4,5-d]pirimidina;
 - 3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-propan-2-iltriazolo[4,5-d]pirimidina;
 - 3-[(2-clorofenil)metil]-5-ciclopropil-7-(3,3-difluor-pirrolidin-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidina;
 - 3-[[5-ciclopropil-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidin-3-il]metil]-4-metil-1,2,5-oxadiazol;

- (3S)-1-[3-[(2-clorofenil)metil]-5-prop-1-en-2-iltriazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]pirrolidin-3-ol;
- 3-[(2-clorofenil)metil]-5,7-di(piperidin-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidina;
- 3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-N-etiltriazolo[4,5-d]pirimidina-5-
5 amina;
- 5-(azetidin-1-il)-3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluor-pirrolidin-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidina;
- 3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-pirrolidin-1-iltriazolo[4,5-d]pirimidina;
- 10 3-[(2-clorofenil)metil]-N-ciclobutil-7-(3,3-difluor-pirrolidin-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidina-5-amina;
- N-tert-butil-3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluor-pirrolidin-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidina-5-amina;
- 3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-N-(3-metiloxetan-3-il)triazolo[4,5-d]pirimidina-5-amina;
- 15 4-[3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-triazolo[4,5-d]pirimidin-5-il]morfolina;
- N-tert-butil-3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluor-pirrolidin-1-il)-N-metiltriazolo[4,5-d]pirimidina-5-amina;
- 20 3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-N-(2,2-dimetilpropil)triazolo[4,5-d]pirimidina-5-amina;
- 3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-N-(oxetan-3-il)triazolo[4,5-d]pirimidina-5-amina;
- 3-[(2-clorofenil)metil]-N-ciclobutil-7-(3,3-difluor-pirrolidin-1-il)-N-metiltriazolo[4,5-d]pirimidina-5-amina;
- 25 (3S)-1-[5-(tert-butilamino)-3-[(4-metoxifenil)metil]-triazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]pirrolidin-3-ol;
- N-tert-butil-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-3-[(4-metoxi-fenil)metil]triazolo[4,5-d]pirimidina-5-amina;
- 30 N-[(3S)-1-[5-(tert-butilamino)-3-[(4-metoxifenil)metil]-triazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]pirrolidin-3-il]acetamida;
- N-tert-butil-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-3-[[2-(trifluor-metil)fenil]metil]triazolo[4,5-d]pirimidina-5-amina;
- N-tert-butil-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-3-[(2-metil-sulfonilfenil)metil]triazolo[4,5-d]pirimidina-5-amina;
- 35 N-tert-butil-3-[(3-cloropiridin-2-il)metil]-7-(3,3-difluor-pirrolidin-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidina-5-amina;

N-tert-butil-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-3-[(1-metil-tetrazol-5-il)metil]triazolo[4,5-d]pirimidina-5-amina;

N-tert-butil-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-3-[(4-metil-1,2,5-oxadiazol-3-il)metil]triazolo[4,5-d]pirimidina-5-amina;

5 N-[(3S)-1-[5-(tert-butilamino)-3-[(3-cloropiridin-2-il)-metil]triazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]pirrolidin-3-il]-acetamida;

(3S)-1-[5-(tert-butilamino)-3-[(2-clorofenil)metil]triazolo-[4,5-d]pirimidin-7-il]pirrolidin-3-ol;

10 (3S)-1-[5-(tert-butilamino)-3-[(1-metiltetrazol-5-il)metil]-triazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]pirrolidin-3-ol;

(3S)-1-[5-(tert-butilamino)-3-[(4-metoxifenil)metil]triazolo-[4,5-d]pirimidin-7-il]-3-metilpirrolidin-3-ol;

(3R)-1-[5-(tert-butilamino)-3-[(4-metoxifenil)metil]triazolo-[4,5-d]pirimidin-7-il]-3-metilpirrolidin-3-ol;

15 (3S)-1-[3-[(2-clorofenil)metil]-5-morfolin-4-iltriazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]-3-metilpirrolidin-3-ol;

(3S)-3-metil-1-[5-morfolin-4-il-3-[[2-(trifluormetil)fenil]-metil]triazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]pirrolidin-3-ol;

20 (3S)-1-[3-[(3-cloropiridin-2-il)metil]-5-morfolin-4-il-triazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]-3-metilpirrolidin-3-ol;

(3S)-3-metil-1-[3-[(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)metil]-5-morfolin-4-iltriazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]pirrolidin-3-ol;

(3R)-1-[3-[(2-clorofenil)metil]-5-morfolin-4-iltriazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]-3-metilpirrolidin-3-ol;

25 (3R)-3-metil-1-[5-morfolin-4-il-3-[[2-(trifluormetil)fenil]-metil]triazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]pirrolidin-3-ol;

(3R)-3-metil-1-[3-[(2-metilsulfonilfenil)metil]-5-morfolin-4-iltriazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]pirrolidin-3-ol;

30 (3R)-3-metil-1-[3-[(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)metil]-5-morfolin-4-iltriazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]pirrolidin-3-ol;

3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-(2,2,2-trifluoretoxi)triazolo[4,5-d]pirimidina;

3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-(1,1,1-trifluorpropan-2-iloxi)triazolo[4,5-d]pirimidina;

35 3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-[(2S)-1,1,1-trifluorpropan-2-il]oxitriazolo[4,5-d]pirimidina;

- 3-[(2-clorofenil)metil]-5-(2,2-difluoretoxi)-7-(3,3-difluor-pirrolidin-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidina;
- 3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-etoxitriazolo[4,5-d]pirimidina;
- 5-butoxi-3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidina;
- 5 3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-(2-fluoretoxi)triazolo[4,5-d]pirimidina;
- 3-[(2-clorofenil)metil]-5-(ciclopropilmetoxi)-7-(3,3-difluor-pirrolidin-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidina;
- 3-[(2-clorofenil)metil]-5-ciclobutiloxi-7-(3,3-difluor-pirrolidin-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidina;
- 10 3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-(oxetan-3-iloxi)triazolo[4,5-d]pirimidina;
- 3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-[(3-metiloxetan-3-il)metoxi]triazolo[4,5-d]pirimidina;
- 15 3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-[(2R)-1,1,1-trifluorpropan-2-il]oxitriazolo[4,5-d]pirimidina;
- 3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-(2,2-dimetilpropoxi)triazolo[4,5-d]pirimidina;
- 3-[(2-clorofenil)metil]-5-(2,2-difluorpropoxi)-7-(3,3-di-fluorpirrolidin-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidina;
- 20 3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-(2-metilpropoxi)triazolo[4,5-d]pirimidina;
- 3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-propan-2-iloxitriazolo[4,5-d]pirimidina;
- 25 3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-prop-2-inoxitriazolo[4,5-d]pirimidina;
- 3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-(1-metoxipropan-2-iloxi)triazolo[4,5-d]pirimidina;
- 1-[3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-triazolo[4,5-d]pirimidin-5-il]oxi-2-metilpropan-2-ol;
- 30 3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-propoxitriazolo[4,5-d]pirimidina;
- (3S)-1-[3-[(2-clorofenil)metil]-5-(2,2,2-trifluoretoxi)-triazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]pirrolidin-3-ol;
- (3S)-1-[5-(2,2,2-trifluoretoxi)-3-[[2-(trifluormetil)fenil]-metil]triazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]pirrolidin-3-ol;
- 35 (3S)-1-[3-[(2-clorofenil)metil]-5-propan-2-iloxitriazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]pirrolidin-3-ol;

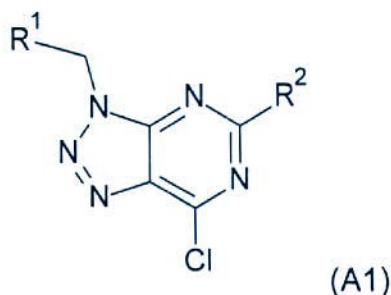
- (3S)-1-[3-[(2-metilsulfonilfenil)metil]-5-propan-2-iloxi-triazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]pirrolidin-3-ol;
- (3S)-1-[3-[(1-metiltetrazol-5-il)metil]-5-propan-2-iloxi-triazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]pirrolidin-3-ol;
- 5 7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-(2,2-dimetilpropoxi)-3-[(1-metiltetrazol-5-il)metil]triazolo[4,5-d]pirimidina;
- 7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-(2,2-dimetilpropoxi)-3-[(2-metilsulfonilfenil)metil]triazolo[4,5-d]pirimidina;
- 10 3-[[7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-(2,2-dimetilpropoxi)-triazolo[4,5-d]pirimidin-3-il]metil]-4-metil-1,2,5-oxadiazol;
- 7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-3-[[2-(trifluormetil)fenil]-metil]-5-[(2S)-1,1,1-trifluorpropan-2-il]oxitriazolo[4,5-d]-pirimidina;
- 7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-3-[(2-metilsulfonilfenil)-metil]-5-[(2S)-1,1,1-trifluorpropan-2-il]oxitriazolo[4,5-d]-pirimidina;
- 15 3-[(3-cloropiridin-2-il)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-[(2S)-1,1,1-trifluorpropan-2-il]oxitriazolo[4,5-d]-pirimidina;
- 2-[[7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-[(2S)-1,1,1-trifluor-propan-2-il]oxitriazolo[4,5-d]pirimidin-3-il]metil]-5-metil-1,3,4-oxadiazol;
- 5-[[7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-[(2S)-1,1,1-trifluor-propan-2-il]oxitriazolo[4,5-d]pirimidin-3-il]metil]-3-metil-1,2,4-oxadiazol;
- 20 7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-3-[(1-metiltetrazol-5-il)-metil]-5-[(2S)-1,1,1-trifluorpropan-2-il]oxitriazolo[4,5-d]-pirimidina;
- 3-[[7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-[(2S)-1,1,1-trifluor-propan-2-il]oxitriazolo[4,5-d]pirimidin-3-il]metil]-4-metil-1,2,5-oxadiazol;
- 25 7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-[(2S)-1,1,1-trifluorpropan-2-il]oxi-3-(3,3,3-trifluorpropil)triazolo[4,5-d]pirimidina;
- 3-[(1-ciclopropiltetrazol-5-il)metil]-7-(3,3-difluor-pirrolidin-1-il)-5-[(2S)-1,1,1-trifluorpropan-2-il]oxi-triazolo[4,5-d]pirimidina;
- N-[(3S)-1-[3-[(2-clorofenil)metil]-5-(2,2-dimetilpropoxi)-triazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]pirrolidin-3-il]acetamida;
- 30 N-[(3S)-1-[3-[(3-cloropiridin-2-il)metil]-5-(2,2-dimetil-propoxi)triazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]pirrolidin-3-il]-acetamida;
- N-[(3S)-1-[5-(2,2-dimetilpropoxi)-3-[(4-metil-1,2,5-oxadiazol-3-il)metil]triazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]-pirrolidin-3-il]acetamida;
- 35 N-[(3S)-1-[3-[(2-clorofenil)metil]-5-[(2S)-1,1,1-trifluor-propan-2-il]oxitriazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]pirrolidin-3-il]acetamida;

- N-[(3S)-1-[3-[[2-(trifluorometil)fenil]metil]-5-[(2S)-1,1,1-trifluoropropan-2-il]oxitriazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]-pirrolidin-3-il]acetamida;
- 3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-etilsulfaniltriazolo[4,5-d]pirimidina;
- 5 3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-(2,2,2-trifluoretilsulfanil)triazolo[4,5-d]pirimidina;
- 3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-propan-2-ilsulfaniltriazolo[4,5-d]pirimidina;
- 5-tert-butilsulfanil-3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluor-pirrolidin-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidina;
- 10 3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-etilsulfoniltriazolo[4,5-d]pirimidina;
- 5-bencilsulfonil-3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluor-pirrolidin-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidina;
- 15 3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-propan-2-ilsulfoniltriazolo[4,5-d]pirimidina;
- 2-[3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-triazolo[4,5-d]pirimidin-5-il]sulfaniletanol;
- 1-[3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-triazolo[4,5-d]pirimidin-5-il]sulfanilpropan-2-ol;
- 20 5-butilsulfanil-3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluor-pirrolidin-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidina;
- 3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-(2-metilpropilsulfanil)triazolo[4,5-d]pirimidina;
- 25 5-butilsulfonil-3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluor-pirrolidin-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidina;
- 3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-(2-metilpropilsulfonil)triazolo[4,5-d]pirimidina;
- 1-[3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-triazolo[4,5-d]pirimidin-5-il]sulfonilpropan-2-ol;
- 30 3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-(2-metoxietilsulfonil)triazolo[4,5-d]pirimidina; y
- N-[(3S)-1-[5-(tert-butilamino)-3-[(2-clorofenil)metil]-triazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]pirrolidin-3-il]acetamida.
- 35 10. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones de 1 a 9, elegido entre:

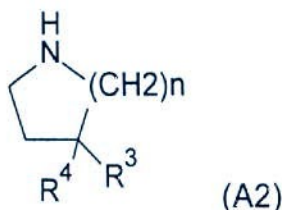
- 3-[(2-clorofenil)metil]-5-ciclobutil-7-(3,3-difluor-pirrolidin-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidina;
- 3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-propan-2-iltriazolo[4,5-d]pirimidina;
- 5 N-tert-butil-3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluor-pirrolidin-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidina-5-amina;
- N-tert-butil-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-3-[(2-metil-sulfonilfenil)metil]triazolo[4,5-d]pirimidina-5-amina;
- 3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-(2,2-dimetilpropoxi)triazolo[4,5-d]pirimidina;
- 10 3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-(2-metilpropoxi)triazolo[4,5-d]pirimidina;
- (3S)-1-[3-[(2-clorofenil)metil]-5-(2,2,2-trifluoretoxi)-triazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]pirrolidin-3-ol;
- 15 7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-3-[[2-(trifluormetil)fenil]-metil]-5-[(2S)-1,1,1-trifluorpropan-2-il]oxitriazolo[4,5-d]-pirimidina;
- 3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluorpirrolidin-1-il)-5-etilsulfaniltriazolo[4,5-d]pirimidina; y
- 5-tert-butilsulfanil-3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3,3-difluor-pirrolidin-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidina.
- 20

11. Un proceso de síntesis de un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones de 1 a 10, que consta de los pasos siguientes:

(a) la reacción de un compuesto de la fórmula (A1)

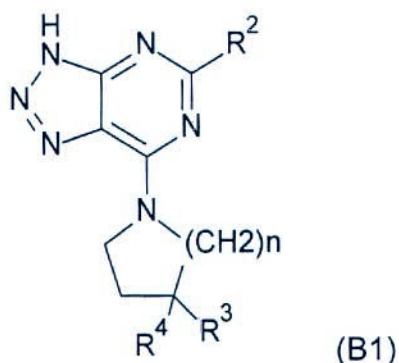


en presencia de un compuesto de la fórmula (A2)



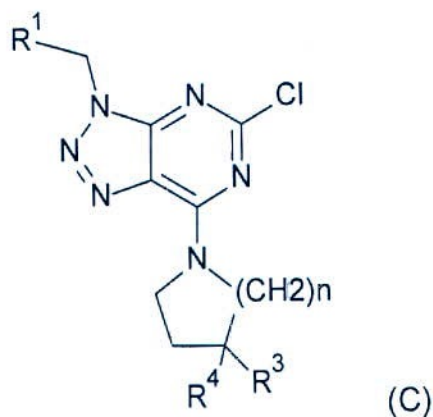
en las que R² es isopropilo, cicloalquilo o alquenilo y R¹, R³, R⁴ y n tienen los significados definidos en una cualquiera de las reivindicaciones de 1 a 8;

(b) la reacción de un compuesto de la fórmula (B1)



en presencia de R^1CH_2X , en el que X es un halógeno, un grupo hidroxilo o sulfonato, en la que R^2 es isopropilo, cicloalquilo o alqueno y en la que de R^3 a R^4 y n tienen los significados definidos en una cualquiera de las reivindicaciones de 1 a 8;

(c) la reacción de un compuesto de la fórmula (C1)



en presencia de R^2-H , en el que R^2 es piperidinilo, alquil-amino, azetidino, pirrolidinilo, cicloalquilamino, alquil-oxetanilamino, morfolinilo, (cicloalquil)(alquil)amino, halo-alquilo, alcoxi, cicloalquilalcoxi, cicloalquilo, oxetanilo, alquilo, alquiloalquilo, alquiloalcoxi, hidroalquilo, alquilsulfanilo, haloalquil-sulfanilo, alquilsulfonilo, hidroalquilsulfanilo, hidroalquilsulfonilo o alcoxialquilsulfonilo y en la que R^1 , R^3 , R^4 y n tienen los significados definidos en una cualquiera de las reivindicaciones de 1 a 8.

12. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones de 1 a 10, cuando se obtiene con arreglo al proceso de la reivindicación 11.

13. Una composición farmacéutica que contiene un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones de 1 a 10 y un vehículo terapéuticamente inerte.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800.176.089-2

- / -



RECIBO DE CAJA

No. 16 - 0025700

Bogotá D.C., Marzo 15 de 2016 - 12:13:05

RECIBIDO DE : LLOREDA & CIA. S.A.

NI 830.022.145

***** Soporte del Pago *****

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	715484851	15/03/2016	6.028.000.00

***** Conceptos Pagados *****

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
3 50005-01-01 SOLICITUDES	1607 REIVINDICACION PATENTE UNITARIA ADICIONAL A LAS 10 INIC	40.000.00	120.000.00
			\$120.000.00

SON: **CIENTO VEINTE MIL PESOS MONEDA CORRIENTE**

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 15-308203- -00003-0000

Fecha: 2016-03-16 16:37:26 Dep. 2020 DIR NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 12

Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C.- Colombia

Web: www.sic.gov.co e-mai: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870264 Línea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

Marzo 15 de 2016 - 12:13:36