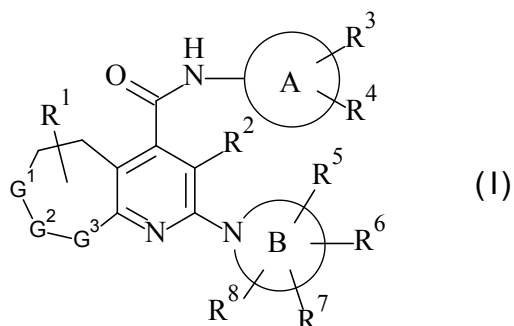


REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la fórmula (I) o una de sus sales:

[Quim. 26]



(en la fórmula,

R¹ es H o alquilo inferior,

R² es H o CN,

cualquiera de G¹, G² y G³ es O, y los otros dos de G¹, G² y G³ son CH₂,

el anillo A es arilo C₆₋₁₀, o heteroarilo de 6 miembros que contiene nitrógeno,

el anillo B es amino cíclico,

R³ y R⁴ son iguales o diferentes entre sí, y son H, halógeno, alquilo inferior, – alquilenio inferior–OH, halo–alquilo inferior, –O–alquilo inferior, –O–halo–alquilo inferior, cicloalquilo, CN, OH, –N(alquilo inferior)₂, o –C(=O)NH₂,

R⁵, R⁶, R⁷ y R⁸ son iguales o diferentes entre sí, y son H, halógeno, alquilo inferior, halo–alquilo inferior, –O–alquilo inferior, o CN, o

en el caso donde R⁵ y R⁶ están enlazados al mismo átomo de carbono, R⁵ y R⁶ pueden formar cicloalcano C₃₋₇ o éter cíclico C₃₋₈ junto con el átomo de carbono, y pueden formar un anillo espiro junto con el anillo B, o

el anillo B puede formar 6,7–dihidro[1,3]oxazolo[4,5–c]piridin–5(4H)–ilo junto con R⁵ y R⁶.

2. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 1, donde:

R¹ es H,

R² es H,

G¹ es O,

G² y G³ son CH₂,

el anillo A es fenilo, o heteroarilo de 6 miembros que contiene nitrógeno,

el anillo B es amino cíclico de 5 o 6 miembros, y

R⁵, R⁶, R⁷ y R⁸ son iguales o diferentes entre sí, y son H, halógeno, alquilo inferior, halo-alquilo inferior, -O-alquilo inferior, o CN.

3. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 2, donde:

el anillo A es heteroarilo monocíclico de 6 miembros que contiene nitrógeno,

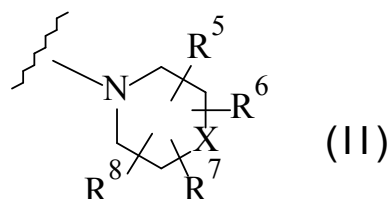
R³ es H o alquilo inferior, y

R⁴ es H, halógeno, alquilo inferior, -alquilenol inferior-OH, halo-alquilo inferior, -O-alquilo inferior, -O-halo-alquilo inferior, cicloalquilo, CN, OH, -N(alquilo inferior)₂, o-C(=O)NH₂.

4. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 3, donde:

el anillo B y R⁵, R⁶, R⁷ y R⁸ son la fórmula (II):

[Quim. 27]



X es CH₂, O, o un enlace,

en el caso donde X es CH₂, R⁵ y R⁶ pueden estar sustituidos con X, y

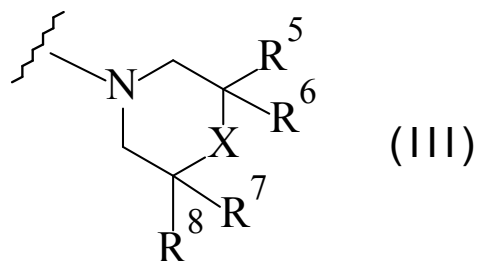
R⁵, R⁶, R⁷ y R⁸ son iguales o diferentes entre sí, y son H, halógeno, alquilo inferior, o halo-alquilo inferior.

5. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, donde X es CH₂ u O.
6. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, donde X es un enlace.
7. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 5, donde

el anillo A es heteroarilo de 6 miembros que contiene nitrógeno que tiene uno o dos átomos de nitrógeno como átomos de anillo,

el anillo B, y R⁵, R⁶, R⁷ y R⁸ son la fórmula (III):

[Quim. 28]



R⁵ es Halógeno o alquilo inferior,

R⁶ es H,

R⁷ es H, y

R⁸ es H o alquilo inferior.

8. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 7, donde:

el anillo A es piridilo,

X es CH₂,

R⁵ es halógeno, y

R⁸ es H.

9. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 7, donde:

el anillo A es piridilo,

X es O,

R⁵ es alquilo inferior, y

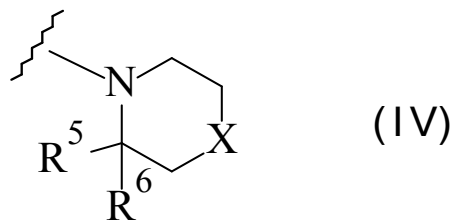
R⁸ es alquilo inferior.

10. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 6, donde:

el anillo A es heteroarilo de 6 miembros que contiene nitrógeno que tiene dos átomos de nitrógeno como átomos de anillo,

el anillo B y R⁵, R⁶, R⁷ y R⁸ son la fórmula (IV):

[Quim. 29]



R⁵ es halógeno o alquilo inferior,

R⁶ es H,

R⁷ es H, y

R⁸ es H.

11. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 1, que se selecciona del grupo que consiste en:

N-(5-cloropiridin-2-il)-2-[(2R,6S)-2,6-dimetilmorfolin-4-il]-5,6,8,9-tetrahidrooxepino[4,5-b]piridina-4-carboxamida,

N-(6-metoxipiridazin-3-il)-2-[(2R)-2-metilpirrolidin-1-il]-5,6,8,9-tetrahidrooxepino[4,5-b]piridina-4-carboxamida,

N-(6-metilpirazin-2-il)-2-[(2S)-2-metilpirrolidin-1-il]-5,6,8,9-tetrahidrooxepino[4,5-b]piridina-4-carboxamida,

2-[(2R)-2-etilmorfolin-4-il]-N-(6-metilpiridin-3-il)-5,6,8,9-tetrahidrooxepino[4,5-b]piridina-4-carboxamida,

2-(4-fluorpiriperidin-1-il)-N-(piridazin-3-il)-5,6,8,9-tetrahidrooxepino[4,5-b]piridina-4-carboxamida,

N-(5,6-dimetilpirazin-2-il)-2-[(2S)-2-metilpirrolidin-1-il]-5,6,8,9-tetrahidrooxepino[4,5-b]piridina-4-carboxamida,

2-[(2S)-2-metilpiperidin-1-il]-N-(piridazin-3-il)-5,6,8,9-tetrahidrooxepino[4,5-b]piridina-4-carboxamida,

2-[(2S)-2-metilpiperidin-1-il]-N-(pirazin-2-il)-5,6,8,9-tetrahidrooxepino[4,5-b]piridina-4-carboxamida, y

N-(5-cloropiridin-2-il)-2-[(3S)-3-fluorpiperidin-1-il]-5,6,8,9-tetrahydrooxepino[4,5-b]piridina-4-carboxamida.

12. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 11, que es N-(5-cloropiridin-2-il)-2-[(2R,6S)-2,6-dimetilmorfolin-4-il]-5,6,8,9-tetrahydrooxepino[4,5-b]piridina-4-carboxamida o una de sus sales.
13. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 11, que es N-(6-metoxipiridazin-3-il)-2-[(2R)-2-metilpirrolidin-1-il]-5,6,8,9-tetrahydrooxepino[4,5-b]piridina-4-carboxamida o una de sus sales.
14. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 11, que es N-(5-cloropiridin-2-il)-2-[(3S)-3-fluorpiperidin-1-il]-5,6,8,9-tetrahydrooxepino[4,5-b]piridina-4-carboxamida fosfato.
15. Una composición farmacéutica que comprende el compuesto o su sal de acuerdo con la reivindicación 1, y un excipiente farmacéuticamente aceptable.

Señor
DIRECTOR DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
E. S. D.

REF: Expediente No. **NC2018/0002472**, solicitud de patente de invención a favor de
ASTELLAS PHARMA INC. Título: **“COMPUESTO DE
TETRAHIDROOXEPINOPIRIDINA”**

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 Oficio No. 1956 relacionado con la patentabilidad de la presente invención y notificado el 3 de mayo de 2019.

1. Título

Teniendo en cuenta las observaciones realizadas por la examinadora, me permito señalar que el título de la presente solicitud ha sido modificado a **“COMPUESTOS DE TETRAHIDROOXEPINOPIRIDINA COMO MODULADORES DE RECEPTORES DE ACETILCOLINA NICOTINICO $\alpha 7$ ”**, de manera que este permite distinguir de manera clara el objeto que busca ser protegido mediante esta solicitud.

2. Reivindicaciones relativas a un uso

Con base en las observaciones realizadas por la examinadora respecto a la materia de la anterior reivindicación 16, me permito indicar que dicha reivindicación fue cancelada del pliego reivindicatorio, de forma que consideramos superada esta objeción.

3. Reivindicaciones

Respecto a la objeción sobre la claridad de las reivindicaciones, me permito señalar que los términos “*cicloalcano*” y “*éter cíclico*” fueron restringidos de manera que ahora se limita el número de átomos de carbono en cada uno de estos grupos, específicamente, se define que el cicloalcano es un “*cicloalcano C₃₋₇*” y que el éter cíclico es un “*éter cíclico C₃₋₈*”, esto basado en la información proporcionada inicialmente en el Capítulo Descriptivo de la presente solicitud, por ejemplo, como se muestra a continuación:

“El “cicloalcano” es un anillo hidrocarburo saturado que tiene 3 a 7 átomos de anillo (de aquí en adelante, referido también como C₃₋₇ cicloalcano), por ejemplo, ciclopropano, ciclobutano, ciclopentano, ciclohexano, cicloheptano, o similares; en una forma de realización, C₃₋₆ cicloalcano; y en una forma de realización, ciclopropano.”

(Página 9, líneas 8 – 12).

“El “éter cíclico” es un anillo saturado que tiene 3 a 8 átomos de anillo y que contiene solo 1 o 2 átomos de oxígeno como un heteroátomo, por ejemplo, oxirano, oxetano, oxolano, dioxolano, oxano, dioxano, oxepano, oxocano, o similares; en una forma de realización, éter cíclico de 3 a 6 miembros; y en una forma de realización, oxetano.”

(Página 10, líneas 8 – 12).

Adicionalmente, para el caso de los términos “arilo” y “heteroarilo” también se restringió su alcance al número de átomos de carbono de cada uno de estos grupos, todo esto basado en la información proporcionada en el Capítulo Descriptivo, como sigue:

“El “arilo” es un grupo anillo hidrocarburo aromático formado mediante la remoción de un átomo de hidrógeno de un anillo hidrocarburo aromático monocíclico o bicíclico que tiene 6 a 10 átomos de carbono (en adelante, referido también como C₆₋₁₀ arilo), por ejemplo, fenilo o naftilo; y en una forma de realización, fenilo.”

(Página 10, líneas 13 – 17).

“El “heteroarilo que contiene nitrógeno” es un grupo formado por la remoción de un átomo de hidrógeno de un anillo hetero aromático monocíclico o bicíclico, que tiene uno o más átomos de nitrógeno como átomos de anillo y puede además tener uno o más átomos de oxígeno o átomos de azufre como átomos de anillo.”

(Página 10, líneas 18 – 25).

Teniendo en cuenta estas modificaciones, consideramos que el Capítulo Reivindicatorio es completamente claro y define el compuesto de la presente invención de manera clara y precisa.

En vista de lo anteriormente expuesto, respetuosamente solicito 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.

Anexos

- Nuevo pliego reivindicatorio.

Atentamente,

JUAN PABLO CADENA SARMIENTO

T.P. No. 57.492 del C.S.J.

C.C. 80.410.337 de Usaquén

Calle 70 A No. 4 – 41