

282
297

CAVELIER
ABOGADOS

WEB SITE: www.cavelier-abogados.com
E-MAIL: cavelier@colomsat.net.co

EDIFICIO SISKI
CARRERA 4 No 70-35
BOGOTÁ 8, CC

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

TELÉFONO: (57) (1) 347-3611
310-4995

Radicación : 00002439 00000002

Folios: 14

Fecha (A/D): 2000-05-03 17:04:01

Trámite : 032 PATENTES D 1 REGISTRO/ 444 REPUESTA

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Señora Jefe de la
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

TRAMITE:02 - EVENTO:01 - ACTUACION:08

Referencia : Expediente No. 00.002.439

Solicitante : BOEHRINGER INGELHEIM PHARMACEUTICALS,
INC.

Asunto : Solicitud de patente para: **COMPUESTOS
HETEROCICLICOS AROMATICOS COMO AGENTES
ANTIINFLAMATORIOS.**

Fecha de la solicitud : 18 de enero de 2000.

1. Yo, Emilio FERRERO, obrando como apoderado del solicitante en el asunto antes identificado, me refiero al auto número 0093, notificado por estado del 16 de marzo de 2000.

2. Mediante el auto número 0093 se puso en conocimiento del solicitante el informe que contiene las observaciones hechas por ese Despacho sobre la presente solicitud de patente. Atiendo a las observaciones de la manera siguiente:

2.1. En las reivindicaciones. Presento junto con este escrito nuevas páginas 73 a 78, correspondientes al capítulo reivindicatorio, en las cuales se han hecho todas las modificaciones solicitadas por ese Despacho de la siguiente manera:

La reivindicación 12 se ha hecho dependiente de la reivindicación 1.

RESPUESTA AUTO No 0093 DEL ESTADO
DEL DIA 16 de marzo de 2000

La reivindicación 14 se ha eliminado.

La reivindicación 15 se ha hecho dependiente de la 1 haciendo algunas modificaciones a la dicha reivindicación.

La reivindicación 21 se ha caracterizado por cada uno de los componentes de la composición por lo tanto dicha reivindicación se revisó y corrigió.

2.2. Arte Final. Adjunto a este memorial presento los artes finales de acuerdo con lo requerido.

2.3. Copia Certificada. La copia certificada No. 60/116.400 del 19 de enero de 1999 se presentó junto con el memorial 00002439 00000001 del 12 de abril de 2000

2.4. Recibos. Presento con este escrito el recibo de pago por valor de \$ 486.100.00 por concepto de los derechos de publicación por palabra adicional.

3. Puesto que se han atendido a cabalidad las observaciones hechas por ese Despacho sobre la presente solicitud de patente, atentamente solicito que se continúe su tramitación.

Bogotá, 1-3 MAYO 2000
Señora Jefe,



EMILIO FERRERO
T.P.A. No. 31.929

COLO 07612-801-014-7
RCB-131

7. Un compuesto según la reivindicación 6, donde L es propoxi, etoxi o metoxi, estando cada uno opcionalmente sustituido con 0-2 grupos oxo y uno o más alquilos C_{1-4} ramificados o sin ramificar que pueden estar sustituidos con uno o más átomos de halógeno.

8. Un compuesto según la reivindicación 7, donde L es etoxi opcionalmente sustituido con 0-2 grupos oxo y uno o más alquilos C_{1-4} ramificados o sin ramificar que pueden estar sustituidos con uno o más átomos de halógeno.

9. Un compuesto según la reivindicación 6, donde L es metilo o propilo, estando cada uno de ellos opcionalmente sustituido con 0-2 grupos oxo y uno o más alquilo C_{1-4} ramificados o sin ramificar que pueden estar sustituidos con uno o más átomos de halógeno.

10. Un compuesto según la reivindicación 6, donde L es acetileno C_{3-5} opcionalmente sustituido con 0-2 grupos oxo y uno o más alquilos C_{1-4} ramificados o sin ramificar que pueden estar sustituidos con uno o más átomos de halógeno.

11. Un compuesto según la reivindicación 6, donde L es acetileno C_{3-5} opcionalmente sustituido con 0-2 grupos oxo y uno o más alquilos C_{1-4} ramificados o sin ramificar que pueden estar sustituidos con uno o más átomos de halógeno.

12. Un compuesto según la reivindicación 1, seleccionado del grupo constituido por:

1-[5-terc-butil-2-p-tolil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-morfolin-4-il-etoxi)naftalen-1-il]-urea;

1-[5-terc-butil-2-p-tolil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(cis-2,6-dimetilmorfolin-4-il)etoxi)naftalen-1-il]-urea;

1-[5-terc-butil-2-p-tolil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-(trans-2,6-dimetilmorfolin-4-il)etoxi)naftalen-1-il]-urea;

1-[5-terc-butil-2-p-tolil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-(2-

(metoximetil)morfolin-4-il)etoksi)naftalen-1-il]-urea;
1-[5-terc-butil-2-p-tolil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-(morfolin-4-il)-2-oxoetoksi)naftalen-1-il]-urea;
1-[5-terc-butil-2-p-tolil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-(morfolin-4-il)-2-metiletoksi)naftalen-1-il]-urea;
1-[5-terc-butil-2-p-tolil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-(morfolin-4-il)-1-metiletoksi)naftalen-1-il]-urea;
1-[5-terc-butil-2-p-tolil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-tiomorfolin-4-il-etoksi)naftalen-1-il]-urea;
1-[5-terc-butil-2-p-tolil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-(1-oxotiomorfolin-4-il)etoksi)naftalen-1-il]-urea;
1-[5-terc-butil-2-p-tolil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-morfolin-4-il-etoksi)-3-metilnaftalen-1-il]-urea;
1-[5-terc-butil-2-p-tolil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-(morfolin-4-il-carboniloxo)etoksi)naftalen-1-il]-urea;
1-[5-terc-butil-2-p-tolil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-(tetrahidropiran-4-il)etoksi)naftalen-1-il]-urea;
1-[5-terc-butil-2-p-tolil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-(1-oxo-tetrahidrotiofen-3-il)etoksi)naftalen-1-il]-urea;
1-[5-terc-butil-2-p-tolil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(3-morfolin-4-il-propil)naftalen-1-il]-urea;
1-[5-terc-butil-2-p-tolil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(morfolin-4-il-metil)naftalen-1-il]-urea;
1-[5-terc-butil-2-p-tolil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-piridin-4-il-etil)naftalen-1-il]-urea;
1-[5-terc-butil-2-p-tolil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(3-(tetrahidropiran-2-il-oxi)propin-1-il)naftalen-1-il]-urea;
1-[5-terc-butil-2-p-tolil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(3-(tetrahidropiran-2-il-oxi)propin-1-il)naftalen-1-il]-urea;
1-[5-terc-butil-2-p-tolil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(3-(tetrahidropiran-2-il-oxi)butin-1-il)naftalen-1-il]-urea;
1-[5-terc-butil-2-p-tolil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(3-(piperidin-1-il)propil-1-il)naftalen-1-il]-urea;
1-[5-terc-butil-2-p-tolil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(3-(2-metoximetilmorfolin-4-il)propin-1-il)naftalen-1-il]-urea;
1-[5-terc-butil-2-p-tolil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(piridin-4-il-metoksi)naftalen-1-il]-urea;

1-[5-terc-butil-2-p-tolil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-piridin-4-il-etoxi)naftalen-1-il]-urea;

1-[5-terc-butil-2-p-tolil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(3-piridin-4-il-propoxi)naftalen-1-il]-urea;

1-[5-terc-butil-2-p-tolil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-imidazol-1-il-etoxi)naftalen-1-il]-urea;

1-[5-terc-butil-2-p-tolil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-(3,4-dimetoxifenil)etoxi)naftalen-1-il]-urea;

1-[5-terc-butil-2-p-tolil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(piridin-4-il-metilamino)naftalen-1-il]-urea;

1-[5-iso-propil-2-fenil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-morfolin-4-il-etoxi)naftalen-1-il]-urea;

1-[5-ciclohexil-2-fenil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-morfolin-4-il-etoxi)naftalen-1-il]-urea;

1-[5-(2,2,2-trifluoroetil)-2-fenil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-morfolin-4-il-etoxi)naftalen-1-il]-urea;

1-[5-(1-metilccicloprop-1-il)-2-fenil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-morfolin-4-il-etoxi)naftalen-1-il]-urea;

1-[5-(1-metilciclohex-1-il)-2-fenil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-morfolin-4-il-etoxi)naftalen-1-il]-urea;

1-[5-terc-butil-2-metil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-morfolin-4-il-etoxi)naftalen-1-il]-urea;

1-[5-terc-butil-2-(4-clorofenil)-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-morfolin-4-il-etoxi)naftalen-1-il]-urea;

1-[5-terc-butil-2-butil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-morfolin-4-il-etoxi)naftalen-1-il]-urea;

1-[5-terc-butil-2-(4-metil-3-carbamilfenil)-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-morfolin-4-il-etoxi)naftalen-1-il]-urea;

1-[5-terc-butil-2-(4-metil-3-(morfolin-4-il)metilfenil)-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-morfolin-4-il-etoxi)naftalen-1-il]-urea;

1-[5-terc-butil-2-(4-metil-3-dimetilaminometilfenil)-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-morfolin-4-il-etoxi)naftalen-1-il]-urea;

1-[5-terc-butil-2-(3-dimetilaminometilfenil)-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2morfolin-4-il-etoxi)naftalen-1-il]-urea;

1-[5-terc-butil-2-(2-cloropiridin-5-il)-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-morfolin-4-il-etoxi)naftalen-1-il]-urea;

1-[5-terc-butil-2-(2-metilpiridin-5-il)-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-

morfolin-4-il-etoxi)naftalen-1-il]-urea;
1-[5-terc-butil-2-(2-metoxipiridin-5-il)-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-morfolin-4-il-etoxi)naftalen-1-il]-urea;
1-[5-terc-butil-2-(piridin-3-il)-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-morfolin-4-il-etoxi)naftalen-1-il]-urea;
1-[5-terc-butil-2-(2-metilpiridin-5-il)-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-piridin-4-il-etoxi)naftalen-1-il]-urea;
1-[5-terc-butil-2-(2-metilpiridin-5-il)-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-(trans-2,6-dimetilmorfolin-4-il)etoxi)naftalen-1-il]-urea;
1-[5-terc-butil-2-(2-metilpiridin-5-il)-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(3-morfolin-4-il-propin-1-il)naftalen-1-il]-urea.
y sus ácidos y sales fisiológicamente aceptables.

13. Un compuesto según la reivindicación 12, donde el compuesto es:

1-[5-terc-butil-2-p-tolil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-morfolin-4-il-etoxi)naftalen-1-il]-urea;
1-[5-terc-butil-2-p-tolil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-(1-oxotiomorfolin-4-il)etoxi)naftalen-1-il]-urea;
1-[5-terc-butil-2-(2-metilpiridin-5-il)-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-piridin-4-il-etoxi)naftalen-1-il]-urea;
1-[5-terc-butil-2-(2-metoxipiridin-5-il)-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-morfolin-4-il-etoxi)naftalen-1-il]-urea o
1-[5-terc-butil-2-metil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-morfolin-4-il-etoxi)naftalen-1-il]-urea.

14. El compuesto según la reivindicación 1, donde el compuesto se selecciona del grupo constituido por:

1-[5-terc-butil-2-(3-hidroxil-4-metil-fenil)-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-morfolin-4-il-etoxi)naftalen-1-il]-urea;
1-[5-terc-butil-2-p-tolil-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-(4-hidroximorfolin-4-il)etoxi)naftalen-1-il]-urea;
1-[5-terc-butil-2-(1-hidroxil-6-metil-piridin-3-il)-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-morfolin-4-il-etoxi)naftalen-1-il]-urea;
1-[5-terc-butil-2-(6-metil-piridin-3-il)-2H-pirazol-3-il]-3-[4-(2-(4-hidroximorfolin-4-il)etoxi)naftalen-1-il]-urea;
1-[5-terc-butil-2-(6-metil-piridin-3-il)-2H-pirazol-3-il]-3-[4-

[2-(1-hidroxipiridin-4-il)etoxi]-naftalen-1-il}-urea;

1-[5-terc-butil-2-metil-2H-pirazol-3-il]-3-{4-[2-(4-hidroxi-morfolin-4-il)etoxi]-naftalen-1-il}-urea;

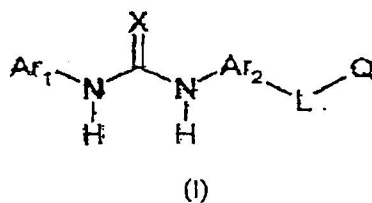
15. Un método para tratar una enfermedad inflamatoria que comprende administrar a un paciente que necesita tal tratamiento, una cantidad terapéuticamente efectiva de un compuesto según la reivindicación 1.

16. El método según la reivindicación 15, donde la enfermedad inflamatoria se selecciona de los grupos constituidos por artritis reumatoide, esclerosis múltiple, síndrome de Guillain-Barre, enfermedad de Crohn, colitis ulcerosa, psoriasis, enfermedad del injerto contra el huésped, lupus eritematoso sistémico y diabetes mellitus insulino dependiente.

17. Un método para tratar una enfermedad autoinmune que comprende administrar a un paciente que necesita tal tratamiento, una cantidad terapéuticamente efectiva de un compuesto según la reivindicación 1.

18. El método según la reivindicación 17, donde la enfermedad autoinmune se selecciona de los grupos constituidos por el síndrome de shock tóxico, osteoartritis, diabetes y enfermedad inflamatorias del intestino.

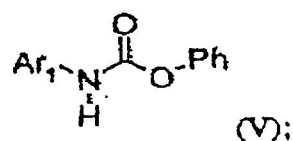
19. Un procedimiento para preparar un compuesto de la fórmula (1) según la reivindicación 1



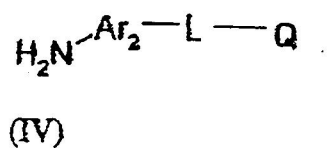
donde X es O y Ar₁, Ar₂, L y Q se definen como en la reivindicación 1,

que comprende:

- (a) hacer reaccionar un aminoheterociclo de la fórmula (II):
 $\text{Ar}_1\text{-NH}_2$ con cloroformiato de fenilo para formar un compuesto de carbamato de la fórmula (V):



- (b) hacer reaccionar el carbamato de la fórmula (V) de la etapa (a) con una arilamina de la fórmula (IV):



para formar un compuesto de la fórmula (I):

21. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto según la reivindicación 1, o sus derivados farmacéuticamente aceptables y portadores y adyuvantes farmacéuticamente aceptables.



FORMATO DE DIGITALIZACION RELACION DE ANEXOS



Royal
Technologies S.A.
Enterprise Content Management E. CM

290

Item	Expediente No	00002439.	No de Folio
		No de unidades	✓
1	CD		
2	DVD		
3	REVISTA		
4	LIBRO		
5	PERIODICO		
6	DISQUETES		
7	SOBRE DE MANILA	I	✓
8	SOBRE BLANCO TAMAÑO CARTA		
9	SOBRE BLANCO TAMAÑO OFICIO		
10	OTROS:		

Observaciones: arte final.

290

-300

ARTE FINAL
EXPEDIENTE No. 00.002.439
BOEHRINGER INGELHEIM PHARMACEUTICALS, INC.

~~30~~ \$486.100.
(5 Puntos)

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

291

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 00002439 00000002
Fecha (AMD): 2023-05-03 17:04:01
Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 444 REPUESTA
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Folios: 14

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 25,479
FECHA : ABRIL 24 DE 2000

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	No. PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050-00024-9	746753	22,315,500.00

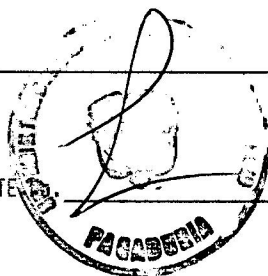
***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-02	PRORROGAS Y RENOVACIONES	395,000.00
30		PRORROGAS Y RENOVACIONES	395,000.00
TOTAL :			\$ 395,000.00

CON: TRESCIENTOS NOVENTA Y CINCO MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE _____



Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5 y 10
Conmutador: 334 12 21
Fax: 281 31 25
Santa Fe de Bogotá, D.C., Colombia

302

292

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicacion : 00002439 00000002

Folios: 14

Fecha (R.D): 2003-05-03 17:04:01

Tramite : 032 PATENTES D 1 REGISTRO/ 444 REPUESTA

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 23,218
FECHA : ABRIL 10 DE 2000

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	Nº. PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050-00024-9	960464	27,251,000.00

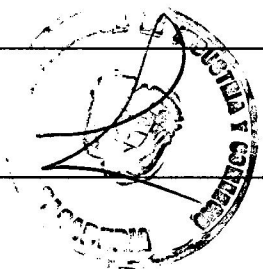
***** CONCEPTO *****

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-03 CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	12 MARCAS Y LEHAS COMERCIALES	68,000.00
	TOTAL :	68,000.00

SON: SESENTA Y OCHO MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____



Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5 y 10
Conmutador: 334 12 21
Fax: 281 31 25
Santa Fe de Bogotá, D.C., Colombia



303
293

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 00002439 000002
Fecha (AMD): 2000-05-03 17:04:01
Tracite : 632 PATENTES D 1 REGISTRO/ 444 REPUESTA
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Folios: 14

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 25,443
FECHA : ABRIL 24 DE 2000

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	No. PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050-00024-9	746753	22,815,500.00

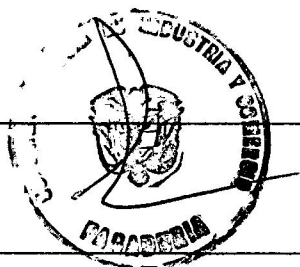
***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I 21 CERTIFICACIONES	7,700.00
TOTAL :			7,700.00

SON: SIETE MIL SETECIENTOS PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.



Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5 y 10
Conmutador: 334 12 21
Fax: 281 31 25
Santa Fe de Bogotá, D.C., Colombia

NIT : 900176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 25,442
FECHA : ABRIL 24 DE 2000

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	No. PAGO	Vr. PAGO
CANELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050-00024-9	746753	22,815,500.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD !	21 CERTIFICACIONES
			7,700.00
TOTAL :			\$ 7,700.00

SON: SIETE MIL SETECIENTOS PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____



305

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

295

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 25,454
FECHA : ABRIL 24 DE 2000

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	No. PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050-00024-9	746753	22,815,500.00

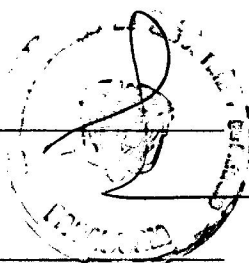
***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	21 CERTIFICACIONES
TOTAL :			\$ 7,700.00
			7,700.00

SON: SIETE MIL SETECIENTOS PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____



Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5 y 10
Conmutador: 334 12 21
Fax: 281 31 25
Santa Fe de Bogotá, D.C., Colombia

14

Reynolds, L. ...
...
Code C7812801314-7