

135 130

Señor
SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
E. S. D.

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 00039601 00000001 Folios: 14
Fecha (AMD): 2000-07-17 15:23:20
Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 329 COMPLEMEN
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Re: P1.-F. HOFFMANN-LA ROCHE A.G.-Solicitud de Patente de Invención para
"DERIVADOS DE 5-FENIL-PIRIMIDINA".-Clase A.61.-Expediente número 00-
039.601.-

1. Me refiero a la solicitud arriba nombrada de 29 de Mayo de 2000.
2. Por medio del presente atentamente me permito nuevamente anexar la traducción oficial correspondiente al capítulo reivindicatorio y a las legalizaciones en la cual se han corregido algunos errores de traducción al igual que se han corregido las fórmulas químicas correspondientes, de la copia auténtica de la solicitud de patente presentada para el invento arriba nombrado **respecto de la cual reclamo prioridad**, a saber la solicitud europea número 99110482.9 de 31 de Mayo de 1999 las cuales fueron presentadas junto con la solicitud arriba nombrada.

Sobre este particular es importante aclarar que la traducción de dicho documento es nuevamente presentada dentro del plazo que el artículo 4D3 del Convenio de París establece. Esto es, dentro del plazo de tres meses contados a partir de la fecha de presentación de la solicitud el cual vence el 29 de Agosto del presente año.
3. Anexo también me permito acompañar copia debidamente autenticada por el Notario Sexto del Circulo de Bogotá de los documentos que acreditan la calidad de traductor oficial del señor Eduardo Calado Noguera, quien elaboró la traducción de la solicitud europea número 99110482.9, respecto de la cual se reivindica prioridad en el presente caso.
4. Ruego a usted tomar atenta nota de lo anterior y proceder de conformidad.

Señor Superintendente,


JOSE ANTONIO LLOREDA
T.P. 10.784
Código 231

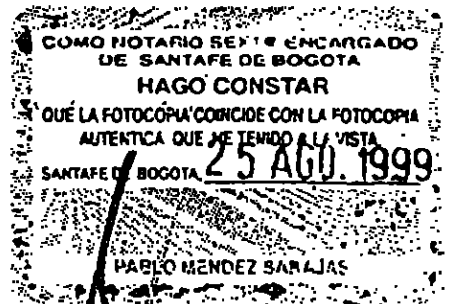
EL SUSCRITO JEFE DEL AREA DE
LEGALIZACIONES DEL MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

CERTIFICA

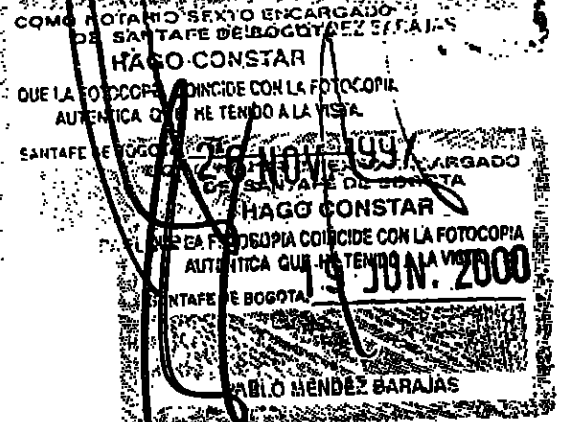
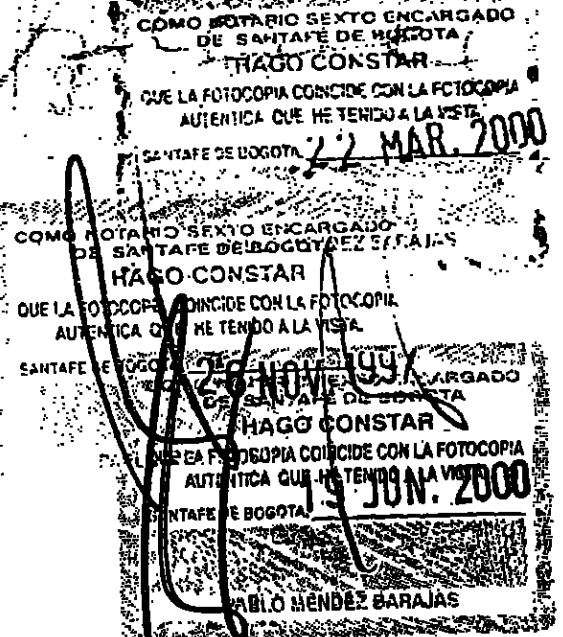
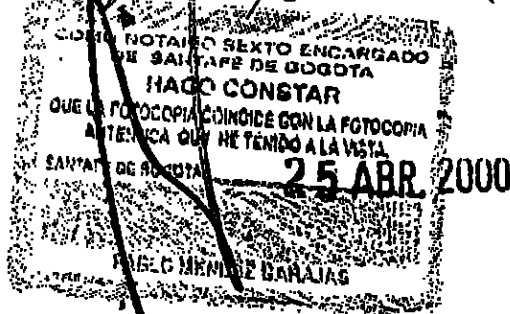
Que revisados los registros que se llevan en la oficina de Legalizaciones aparece la firma del señor **EDUARDO CALADO NOGUERA**, como traductor e intérprete oficial para los idiomas INGLES- ESPAÑOL, ESPAÑOL- INGLES, según resolución 541 del 27 de febrero de 1976.

La anterior certificación se expide a solicitud del interesado quien se identificó con cédula de ciudadanía 17.177.588 expedida en Bogotá.

Dada en Santa Fe de Bogotá, D.C., a los seis (6) de noviembre de 1997.



Blanca Acosta de García
BLANCA ACOSTA DE GARCIA
Jefe Area de Legalizaciones (e)



República de Colombia



Ministerio de Justicia y del Derecho

EL SECRETARIO GENERAL (E) DEL MINISTERIO DE
JUSTICIA Y DEL DERECHO

CERTIFICA:

Que por Resolución 541 del 27 de febrero de 1976, le fue expedida licencia para ejercer funciones de Traductor e Intérprete Oficial en los idiomas INGLÉS y ESPAÑOL al señor EDUARDO CALADO NOGUERA, identificado con la cédula de ciudadanía No. 17.177.588 expedida en Bogotá.

Que dicha Resolución se encuentra vigente en la fecha.

Se expide la presente certificación a solicitud del interesado.

Dada en Santa Fe de Bogotá, D.C., a

14 OCT. 1997

ALVARO NAMEN VARGAS

ICM/mmc

COMO NOTARIO SEXTO ENCARGADO
DE SANTA FE DE BOGOTA
HAGO CONSTAR
QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON LA FOTOCOPIA
AUTENTICA QUE HE TENIDO A LA VISTA.
SANTA FE DE BOGOTA 25 AGO 1999
PABLO MENDEZ BARRAL

COMO NOTARIO SEXTO ENCARGADO
DE SANTA FE DE BOGOTA
HAGO CONSTAR
QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON LA FOTOCOPIA
AUTENTICA QUE HE TENIDO A LA VISTA.
SANTA FE DE BOGOTA 26 NOV 1997

COMO NOTARIO SEXTO ENCARGADO
DE SANTA FE DE BOGOTA
HAGO CONSTAR
QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON LA FOTOCOPIA
AUTENTICA QUE HE TENIDO A LA VISTA.
SANTA FE DE BOGOTA 25 ABR 2000
PABLO MENDEZ BARRAL

COMO NOTARIO SEXTO ENCARGADO
DE SANTA FE DE BOGOTA
HAGO CONSTAR
QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON LA FOTOCOPIA
AUTENTICA QUE HE TENIDO A LA VISTA.
SANTA FE DE BOGOTA 19 JUN 2000
PABLO MENDEZ BARRAL

OFICINA DE PATENTES EUROPEAS**SOLICITUD NO: 99110482.9****SOLICITANTE:****F. HOFFMANN-LA ROCHE AG****4070 BASILEA****SUIZA****FECHA DE REGISTRO: 31/05/99****TITULO DE LA INVENCION:****DERIVADOS DE 5-FENILO-PIRIMIDINA**

Eduardo Colado
Eduardo Colado
-TRADUCCION OFICIAL-
INGLES-ESPAÑOL-ING.
Rev. 24/11/99

14-07-2000 Traducción Oficial No. 294

Caso: 20'386

REF: Hoffmann-La Roche AG

OFICINA DE PATENTES EUROPEAS

CERTIFICADO

Por medio del presente documento se certifica que adjunto se encuentra una fiel copia de los registros de Solicitud de Patentes Europeas, tal como se encuentran en los registros originales.

Número de Solicitud: 99110482.9

Lugar: DEN HAAG, DEN

LA HAYA

FECHA: 03/04/00

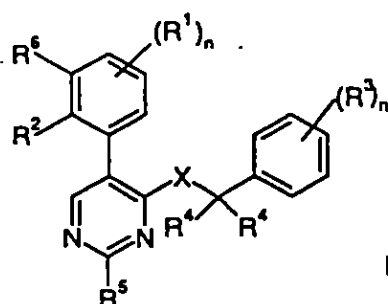
PRESIDENTE DE LA OFICINA DE PATENTES EUROPEAS.

Firma: I. L. C. HATTEN - HECKMAN

Eduardo Calvo
REG. SPT
INGLES-ESPAÑOL-INGLES
- 18 (191) TOR OFICIAL -
1 de marzo de 1996

REIVINDICACIONES:

1. Compuestos de la fórmula general



en la cual

R^1 es hidrógeno o halógeno;

R^2 es hidrógeno, halógeno, alquilo inferior o alcoxi inferior;

R^3 es halógeno, trifluorometilo, alcoxi inferior, alquilo inferior;

R^4 es alquilo inferior, alcoxi inferior, amino, hidróxi, hidróxi - alquilo inferior, $-(CH_2)_n$ -piperazinilo, opcionalmente sustituido por alquilo inferior, $-(CH_2)_n$ -morfolinilo, $-(CH_2)_{n+1}$ -imidazolilo, $-O-(CH_2)_{n+1}$ -morfolinilo, $-O-(CH_2)_{n+1}$ -piperidinilo, alquilo inferior-sulfanilo, alquilo inferior-sulfonilo, bencilamino,

$-NH-(CH_2)_{n+1}N(R^4)_2$, $-(CH_2)_{n+1}N(R^4)_2$, o $-O-(CH_2)_{n+1}N(R^4)_2$;

Edmundo
 Edmundo Caludo
 -TRIDENTOR OTICIL
 INGLÉS-ESPAÑOL-INGLÉS
 Res 541 Febrero de 1986

R^6 es hidrógeno;

R^2 y R^6 o R^1 y R^6 pueden estar unidos $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$, siempre y cuando que n para R^1 sea 0;

y

n es 0 - 2;

X es $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^4)-$ o $-\text{N}(\text{R}^4)\text{C}(\text{O})-$;

y sales de adición ácida farmacéuticamente aceptables de los mismos.

2. Un compuesto de acuerdo a la reivindicación 1, en el cual X es $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^4)-$, R^4 es metilo y R^5 es piperazinilo, opcionalmente sustituido por alquilo inferior.

3. Un compuesto de acuerdo a la reivindicación 2, el cual es

(3,5-bis-trifluorometil-bencil)-metil-amida del ácido 5-(2-cloro-fenil)-2-(4-metil-piperazino-1-il)-pirimidina-4-carboxílico; ó

(3,5-bis-trifluorometil-bencil)-metil-amida del ácido 5-(4-fluor-2-metil-fenil)-2-(4-metil-piperazino-1-il)-pirimidina-4-carboxílico.

Eduardo Calado Noguera
 "TRADUCCIONES OFICIALES"
 INGLES-ESPAÑOL-ING
 R. C. 11.580.000

4. Un compuesto de acuerdo a la reivindicación 1, en el cual X es $-C(O)N(R^4)-$, R^4 es metilo y R^5 es $-O(CH_2)_2$ -morfolinilo.

5. Un compuesto de acuerdo a la reivindicación 4, el cual es

(3,5-bis-trifluorometil-bencil)-metil-amida del ácido 5-(2-cloro-fenil)-2-(2-morfolino-4-il-etoxi)-pirimidina-4-carboxílico.

6. Un compuesto de acuerdo a la reivindicación 1, en el cual X es $-C(O)N(R^4)-$, R^4 es metilo y R^5 es $-NH-(CH_2)_{n+1}N(CH_3)_2$ y n es 1 o 2.

7. Un compuesto de acuerdo a la reivindicación 6, el cual es

(3,5-bis-trifluorometil-bencil)-metil-amida del ácido 5-(2-cloro-fenilo)-2-(2-dimetilamino-etilamino)-pirimidina-4-carboxílico;

(3,5-bis-trifluorometil-bencil)-metil-amida del ácido 2-(2-dimetilamino-etilamino)-5- o -tolil-pirimidina-4-carboxílico;

(3,5-bis-trifluorometil-bencil)-metil-amida del ácido 2-(2-dimetilamino-etilamino)-5- (2-metoxi-fenil)-pirimidina-4-carboxílico;

Eduardo Calado
Eduardo Calado
"TRADUCTOR OFICIAL"
INGLES-ESPAÑOL-ING
Rev. 111 Febrero 1971

(3,5-bis-trifluorometil-bencil)-metil-amida del ácido 2-(2-dimetilamino-etilamino)-5- (4-flúor -fenilo)-pirimidina-4-carboxílico;

(3,5-bis-trifluorometil-bencil)-metil-amida del ácido 2-(2-dimetilamino-etilamino)-5- (4-flúor-2-metil-fenilo)-pirimidina-4-carboxílico;

(3,5-bis-trifluorometil-bencil)-metil-amida del ácido 5-(2-cloro-fenil)-2- (3-dimetilamino-propoxi)-pirimidina-4-carboxílico;

(3,5-bis-trifluorometil-bencil)-metil-amida del ácido 5-(2-cloro-fenil)-2- (2-dimetilamino-etoxi)-pirimidina-4-carboxílico;

(3,5-bis-trifluorometil-bencil)-metil-amida del ácido 2-(2-dimetilamino-etoxi)-5- o -tolil-pirimidina-4-carboxílico;

(3,5-bis-trifluorometil-bencil)-metil-amida del ácido 2-(3-dimetilamino-propoxi)-5- o -tolil-pirimidina-4-carboxílico;

(3,5-bis-trifluorometil-bencil)-metil-amida del ácido 2-(2-dimetilamino-propoxi)-5-(2-metoxi-fenil) pirimidina-4-carboxílico;

(3,5-bis-trifluorometil-bencil)-metil-amida del ácido 2-(3-dimetilamino-propoxi)-5-(4-flúor -2-metil-fenil) pirimidina-4-carboxílico;

Edmundo
 REVISADO POR OFICINA
 DE ESPAÑOL-INGLÉS
 11/11/11

(3,5-bis-trifluorometil-bencil)-metil-amida del ácido 2-(2-dimetilamino-etoxi)-5-(4-flúor -2-metil-fenil) pirimidina-4-carboxílico.

8. Un compuesto de acuerdo a la reivindicación 1, en el cual X es $-\text{CON}(\text{R}^4)_2$, R^4 es metilo y R^5 es SCH_3 .

9. Un compuesto de acuerdo a la reivindicación 8, el cual es

(3,5-bis-trifluorometil-bencil)-metil-amida del ácido 2-metilsulfanil-5- o -tolil-pirimidina-4-carboxílico; ó

(3,5-bis-trifluorometil-bencil)-metil-amida del ácido 5-(4-fluoro-2-metil-fenil)-2-metilsulfanil-pirimidina-4-carboxílico.

10. Un compuesto de acuerdo a la reivindicación 1, en el cual X es $-\text{CON}(\text{R}^4)_2$, R^4 es metilo y R^2 y R^6 o R^1 y R^6 son juntos $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$.

11. Un compuesto de acuerdo a la reivindicación 10, el cual es

(3,5-bis-trifluorometil-bencil)-metil-amida del ácido 2-(4-metil-piperazino-1-il)-5-naftalen-1-il-pirimidina-4-carboxílico.

Edwardo Delgado
Edwardo Delgado Sanguera
"TRADUCTOR OFICIAL"
"TRANSLADOR"
Rég. N.º 1.000.000

745

(3,5-bis-trifluorometil-bencil)-metil-amida del ácido 2-(2-dimetilamino-etilamino)-5-naftalen-1-il-pirimidina-4-carboxílico;

(3,5-bis-trifluorometil-bencil)-metil-amida del ácido 2-(2-dimetilamino-etoxi)-5-naftalen-1-il-pirimidina-4-carboxílico;

(3,5-bis-trifluorometil-bencil)-metil-amida del ácido 2-(2-morfolino-4-il-etoxi)-5-naftalen-1-il-pirimidina-4-carboxílico; o

(3,5-bis-trifluorometil-bencil)-metil-amida del ácido 2-(3-dimetilamino-propoxi)-5-naftalen-1-il-pirimidina-4-carboxílico.

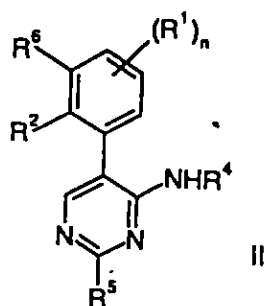
12. Un medicamento que contiene uno o más compuestos tal como lo reclama cualquiera de las reivindicaciones de la 1-11 y excipientes farmacéuticamente aceptables.

13. Un medicamento de acuerdo a las reivindicación 12 para el tratamiento de enfermedades relacionadas con los antagonistas del receptor NK-1.

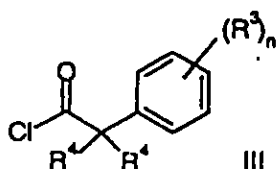
14. Un proceso para la preparación del compuesto de la fórmula I tal como lo define la reivindicación 1, cuyo proceso incluye

Eduardo Ojeda
Eduardo Ojeda
"TRATADO DE DERECHO DE PATENTES"
BOLETIN ESPAÑOL DE PATENTES
FEBRERO DE 1986

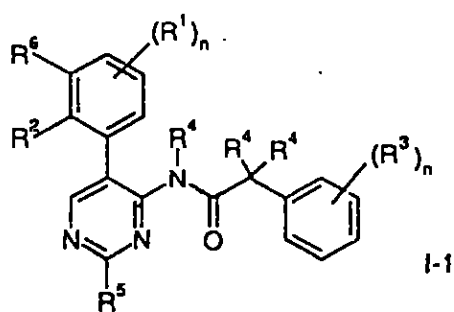
a) reaccionar un compuesto de la fórmula



con un compuesto de la fórmula



en un compuesto de la fórmula



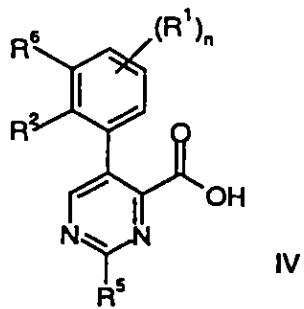
en el cual $R^1 - R^5$ y n tienen el significado que se les da en la reivindicación

1,

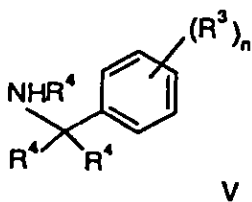
0,

Eduardo Cabello
 Director General
 "TRIPLE FOR OFFICIAL"
 DE ESPAÑOL-INGLÉS
 R. 1766 de 1976

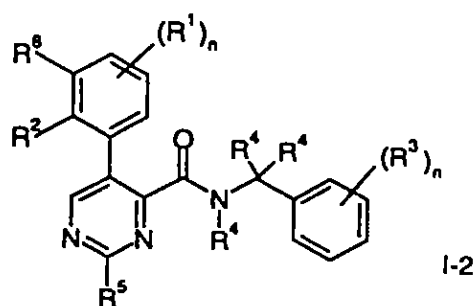
b) reaccionar un compuesto de la fórmula



con un compuesto de la fórmula



para producir un compuesto de la fórmula



en el cual $R^1 - R^5$ y n tienen el significado que se les da en la reivindicación 1, o

Edmundo Calzado
 Edmundo Calzado Vaguerth
 "TR 101" 1018 01. 10. 12.
 INGLES-ESPAÑOL-INGLES
 Res 541, Febrero de 19. 6

c) modificar uno o más sustituyentes de $R^1 - R^5$ con las definiciones que se dieron anteriormente, y

si se desea, convertir el compuesto obtenido en una sal de adición ácida farmacéuticamente aceptable.

15. Un compuesto de acuerdo a las reivindicaciones de la 1-11, cuando se prepare mediante un proceso tal como lo reivindica la reivindicación 14 o por un método equivalente.

16. El uso de un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones de la 1-11 para el tratamiento de enfermedades relacionadas al receptor NK-1 o para la fabricación de un medicamento útil en el tratamiento de enfermedades.

17. El invento que se describió anteriormente.

Edwardo Calzadilla
"TRADUCTOR OFICIAL"
INGLES-ESPAÑOL-INGLES
Rev. 541 Febrero de 1996