

1/10
258

1606312

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-126919- -00001-0000

Fecha: 2009-11-09 16:40:54 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 10

FORMULARIO UNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

1. SOLICITUD DE:

☐ Corrección de Error Material

☒ Modificación a una Solicitud

SOLICITANTE

Nombre: **EXELIXIS, INC**
Dirección: **220 East Grand Avenue, P.O. Box 511**
South San Francisco, CA 94083, US
Nacionalidad o Domicilio:
South Francisco, CA 94083, US
Lugar de Constitución:
Delaware
Teléfono: Fax:
E-mail:

IDENTIFICACION

C.C. ☐ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número: _____

3.
REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: **CARLOS ORLANDO MAYA RODRIGUEZ**
Dirección: **Cr. 13 A No 28-38, Mz 2**
Bufete 230. Parque Central Bavaria
Teléfono **3419841** Fax: **2-435423**
E-mail: **carlos.tamayo@tmtamayo.net**

IDENTIFICACION

C.C. ☒ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número: **17.117.818** TP: **17.402**

4. Número de expediente:

09-126919

5. Descripción de la corrección o modificación solicitada: **EN CUANTO A MODIFICACION:**

A LAS REIVINDICACIONES, SIN EXCEDER EL NIVEL INVENTIVO NI LO

EXPUESTO EN LA MEMORIA DESCRIPTIVA.

SE ANEXAN 16 NUEVAS REIVINDICACIONES

CON EL FIN DE QUE SEAN ESTAS LA ANALIZADAS PARA EL EXAMEN

DE PATENTABILIDAD.

6.

Comprobante de pago No. **09-83,655 Y 09-83658**

Fecha **NOVIEMBRE 09 DE 2009**

7. Anexos

☒ Comprobante de pago de la tasa. (ANEXO RECIBO DE PAGO EXCEDENTE REIVINDICACIONES 09-83,658)

☐ Poderes, si fuere el caso

☐ Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas

8.

NOMBRE:

CARLOS ORLANDO MAYA RODRIGUEZ

FIRMA:

C.C. **17.117.818** TP **17.402**

259

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 83,655
FECHA : NOVIEMBRE 9 DE 2009

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-126919- -00001-0000

Fecha: 2009-11-09 16:40:54 Dep. 2020 NUECREACIONI
Tra. 11 PATENTEIYII Eva: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 10

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CARLOS TAMAYO Y ASOCIADOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	53363170	09/11/2009	3,564,920.00

***** CONCEPTO *****

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

SON: CIENTO ONCE MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 83,658
FECHA : NOVIEMBRE 9 DE 2009

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-126919- -00001-0000

Fecha: 2009-11-09 16:40:54 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 10

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CARLOS TAMAYO Y ASOCIADOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	53363170	09/11/2009	3,564,920.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	*** REIVINDICACION UNITARIA ADICIONAL	25,000.00
		TOTAL :	\$ 25,000.00

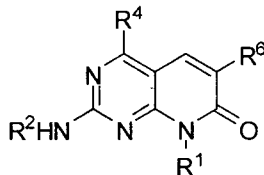
SON: VEINTICINCO MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la fórmula I



I

o uno de sus isómeros individuales, opcionalmente como una sal farmacéuticamente aceptable, de modo adicional opcionalmente como un solvato y de modo adicional opcionalmente como uno de sus hidratos, donde

R¹ es heterocicloalquilo de 5 ó 6 miembros opcionalmente sustituido;

R² es hidrógeno o alquilo;

R⁴ es alquilo opcionalmente sustituido;

R⁶ es heteroarilo de 5 ó 6 miembros opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 ó 5 grupos R⁹;

cada R⁹, cuando está presente, es, de modo independiente, halo, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, ciano, amino, alquilamino, dialquilamino, alcoxialquilo, carboxialquilo, alcoxicarbonilo, aminoalquilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, ariloxi, heterocicloalquilo o heteroarilo y cuando el cicloalquilo, arilo, heterocicloalquilo y heteroarilo, cada uno solo o como parte de otro grupo dentro de R⁹, están opcionalmente sustituidos, de modo independiente, con 1, 2, 3 ó 4 grupos seleccionados de halo, alquilo, haloalquilo, hidroxilo, alcoxi, haloalcoxi, amino, alquilamino y dialquilamino.

2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o uno de sus isómeros individuales, en donde R¹ es un heterocicloalquilo de 5 ó 6 miembros opcionalmente

sustituido, donde el heterocicloalquilo comprende un heteroátomo y el heteroátomo es -O-; donde el compuesto es opcionalmente como una sal farmacéuticamente aceptable, de modo adicional opcionalmente como un solvato y de modo adicional opcionalmente como uno de sus hidratos.

3. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2 o uno de sus isómeros individuales, donde R^6 es un heteroarilo de 5 miembros opcionalmente sustituido con 1, 2 ó 3 grupos R^9 ; donde el compuesto es opcionalmente como una sal farmacéuticamente aceptable, de modo adicional opcionalmente como un solvato y de modo adicional opcionalmente como uno de sus hidratos.

4. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2 o uno de sus isómeros individuales, en donde R^6 es pirazolilo, imidazolilo, tienilo, furanilo, pirrolilo o tiazolilo, cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido con 1, 2 ó 3 grupos R^9 ; donde el compuesto es opcionalmente como una sal farmacéuticamente aceptable, de modo adicional opcionalmente como un solvato y de modo adicional opcionalmente como uno de sus hidratos.

5. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2 o uno de sus isómeros individuales, en donde R^6 es pirazolilo, imidazolilo o tiazolilo, cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido con 1, 2 ó 3 grupos R^9 ; donde el compuesto es opcionalmente como una sal farmacéuticamente aceptable, de modo adicional opcionalmente como un solvato y de modo adicional opcionalmente como uno de sus hidratos.

6. Los compuestos de acuerdo con las reivindicaciones 1, 2, 3, 4 ó 5 o uno de sus isómeros individuales, donde R^2 es hidrógeno; donde el compuesto es opcionalmente como una sal farmacéuticamente aceptable, de modo adicional opcionalmente como un solvato y de modo adicional opcionalmente como uno de sus hidratos.
7. Los compuestos de acuerdo con las reivindicaciones 1, 2, 3, 4 ó 5 o uno de sus isómeros individuales, donde R^2 es etilo o metilo; donde el compuesto es opcionalmente como una sal farmacéuticamente aceptable, de modo adicional opcionalmente como un solvato y de modo adicional opcionalmente como uno de sus hidratos.
8. Los compuestos de acuerdo con las reivindicaciones 1, 2, 3, 4, 5, 6 ó 7 o uno de sus isómeros individuales, donde R^4 es metilo; donde el compuesto es opcionalmente como una sal farmacéuticamente aceptable, de modo adicional opcionalmente como un solvato y de modo adicional opcionalmente como uno de sus hidratos.
9. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 seleccionado de

Nombre
2-amino-4-metil-6-(1H-pirazol-5-il)-8-(tetrahydrofuran-3-il)pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
2-amino-4-metil-6-(1H-pirazol-5-il)-8-[(3S)-tetrahydrofuran-3-il]pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
2-amino-4-metil-6-(1H-pirazol-5-il)-8-[(3R)-tetrahydrofuran-3-il]pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
2-amino-4-metil-6-(1H-pirazol-5-il)-8-(tetrahydro-2H-piran-4-il)pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;

Nombre
2-amino-4-metil-6-(1H-pirazol-5-il)-8-(tetrahidro-2H-piran-3-il)pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
2-amino-4-metil-6-(1H-pirazol-5-il)-8-[(3S)-tetrahidro-2H-piran-3-il]pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
2-amino-4-metil-6-(1H-pirazol-5-il)-8-[(3R)-tetrahidro-2H-piran-3-il]pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
2-amino-4-metil-8-(tetrahidrofuran-3-il)-6-(1,3-tiazol-2-il)pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
2-amino-4-metil-8-[(3S)-tetrahidrofuran-3-il]-6-(1,3-tiazol-2-il)pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
2-amino-4-metil-8-[(3R)-tetrahidrofuran-3-il]-6-(1,3-tiazol-2-il)pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
2-amino-4-metil-8-(tetrahidro-2H-piran-4-il)-6-(1,3-tiazol-2-il)pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
2-amino-4-metil-8-(tetrahidro-2H-piran-3-il)-6-(1,3-tiazol-2-il)pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
2-amino-4-metil-8-[(3S)-tetrahidro-2H-piran-3-il]-6-(1,3-tiazol-2-il)pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
2-amino-4-metil-8-[(3R)-tetrahidro-2H-piran-3-il]-6-(1,3-tiazol-2-il)pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
2-amino-6-(1H-imidazol-2-il)-4-metil-8-(tetrahidrofuran-3-il)pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
2-amino-6-(1H-imidazol-2-il)-4-metil-8-[(3S)-tetrahidrofuran-3-il]pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
2-amino-6-(1H-imidazol-2-il)-4-metil-8-[(3R)-tetrahidrofuran-3-il]pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
2-amino-6-(1H-imidazol-2-il)-4-metil-8-(tetrahidro-2H-piran-4-il)pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
2-amino-6-(1H-imidazol-2-il)-4-metil-8-(tetrahidro-2H-piran-3-il)pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;

Nombre
2-amino-6-(1 <i>H</i> -imidazol-2-il)-4-metil-8-[(3 <i>S</i>)-tetrahidro-2 <i>H</i> -piran-3-il]pirido[2,3- <i>d</i>]pirimidin-7(8 <i>H</i>)-ona;
2-amino-6-(1 <i>H</i> -imidazol-2-il)-4-metil-8-[(3 <i>R</i>)-tetrahidro-2 <i>H</i> -piran-3-il]pirido[2,3- <i>d</i>]pirimidin-7(8 <i>H</i>)-ona;
2-amino-4-metil-8-(tetrahidrofuran-3-il)-6-(1,3-tiazol-5-il)pirido[2,3- <i>d</i>]pirimidin-7(8 <i>H</i>)-ona;
2-amino-4-metil-8-[(3 <i>S</i>)-tetrahidrofuran-3-il]-6-(1,3-tiazol-5-il)pirido[2,3- <i>d</i>]pirimidin-7(8 <i>H</i>)-ona;
2-amino-4-metil-8-[(3 <i>R</i>)-tetrahidrofuran-3-il]-6-(1,3-tiazol-5-il)pirido[2,3- <i>d</i>]pirimidin-7(8 <i>H</i>)-ona;
2-amino-4-metil-8-(tetrahidro-2 <i>H</i> -piran-4-il)-6-(1,3-tiazol-5-il)pirido[2,3- <i>d</i>]pirimidin-7(8 <i>H</i>)-ona;
2-amino-4-metil-8-(tetrahidro-2 <i>H</i> -piran-3-il)-6-(1,3-tiazol-5-il)pirido[2,3- <i>d</i>]pirimidin-7(8 <i>H</i>)-ona;
2-amino-4-metil-8-[(3 <i>S</i>)-tetrahidro-2 <i>H</i> -piran-3-il]-6-(1,3-tiazol-5-il)pirido[2,3- <i>d</i>]pirimidin-7(8 <i>H</i>)-ona; y
2-amino-4-metil-8-[(3 <i>R</i>)-tetrahidro-2 <i>H</i> -piran-3-il]-6-(1,3-tiazol-5-il)pirido[2,3- <i>d</i>]pirimidin-7(8 <i>H</i>)-ona

donde el compuesto es opcionalmente como una sal farmacéuticamente aceptable, de modo adicional opcionalmente como un solvato y de modo adicional opcionalmente como uno de sus hidratos.

10. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 seleccionado de 2-amino-6-{1-[(etiloxi)metil]-1*H*-imidazol-2-il}-4-metil-8-(tetrahidrofuran-3-il)pirido[2,3-*d*]pirimidin-7(8*H*)-ona, 2-amino-6-{1-[(etiloxi)metil]-1*H*-imidazol-2-il}-4-metil-8-[(3*R*)-tetrahidrofuran-3-il]pirido[2,3-*d*]pirimidin-7(8*H*)-ona, 2-amino-6-{1-[(etiloxi)metil]-1*H*-imidazol-2-il}-4-metil-8-[(3*S*)-tetrahidrofuran-3-il]pirido[2,3-*d*]pirimidin-7(8*H*)-ona, 2-

amino-6-{1-[(etiloxi)metil]-1H-imidazol-2-il}-4-metil-8-(tetrahidro-2H-piran-4-il)pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona, 2-Amino-6-{1-[(etiloxi)metil]-1H-imidazol-2-il}-4-metil-8-(tetrahidro-2H-piran-3-il)pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona, 2-amino-6-{1-[(etiloxi)metil]-1H-imidazol-2-il}-4-metil-8-[(3S)-tetrahidro-2H-piran-3-il]pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona y 2-amino-6-{1-[(etiloxi)metil]-1H-imidazol-2-il}-4-metil-8-[(3R)-tetrahidro-2H-piran-3-il]pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona; donde el compuesto es opcionalmente como una sal farmacéuticamente aceptable, de modo adicional opcionalmente como un solvato y de modo adicional opcionalmente como uno de sus hidratos.

11. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8 ó 9 o uno de sus isómeros individuales y un portador, excipiente o diluyente farmacéuticamente aceptables; donde el compuesto es opcionalmente como una sal farmacéuticamente aceptable, de modo adicional opcionalmente como un solvato y de modo adicional opcionalmente como uno de sus hidratos.

12. Uso de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8 ó 9 o uno de sus isómeros individuales, donde el compuesto se encuentra opcionalmente como una sal farmacéuticamente aceptable, de modo adicional opcionalmente como un solvato y de modo adicional opcionalmente como uno de sus hidratos, junto a un portador, excipiente o diluyente farmacéuticamente aceptables, para la fabricación de un medicamento útil para tratar una enfermedad, trastorno o síndrome en un paciente.

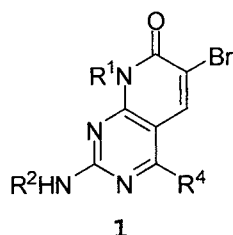
13. El uso de acuerdo con la reivindicación 12, donde la enfermedad es cáncer.

14. El uso de acuerdo con la reivindicación 12, donde el cáncer es cáncer de mama, cáncer de colon, cáncer rectal, cáncer de endometrio, carcinoma gástrico, glioblastoma, carcinoma hepatocelular, cáncer de pulmón de células pequeñas, cáncer de pulmón de células no pequeñas, melanoma, cáncer de ovario, cáncer cervical, cáncer de páncreas, carcinoma de próstata, leucemia mielógena aguda (AML), leucemia mielógena crónica (CML), linfoma no Hodgkin o carcinoma de tiroides.

15. El uso de acuerdo con la reivindicación 12, donde el cáncer es cáncer de ovario, cáncer cervical, cáncer de mama, cáncer de colon, cáncer rectal o glioblastoma.

16. Un método de preparación de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, que comprende:

- (a) hacer reaccionar un intermediario de la fórmula 1



donde R^1 , R^2 y R^4 son como se definen en la reivindicación 1, con un intermediario de la fórmula $R^6\text{Sn}(n\text{-Bu})_3$ o $R^6\text{B}(\text{OH})_2$ donde R^6 y R^9 son como se definen en la reivindicación 1 para obtener un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1;

- (b) opcionalmente también resolver isómeros individuales;
- (c) opcionalmente también modificar uno de los grupos R^1 , R^2 , R^4 y R^6 ; y
- (d) opcionalmente formar una de sus sales, solvatos y/o hidratos farmacéuticamente aceptables.