



No. 10-053458- -00004-0000

Fecha: 2011-09-29 11:32:00 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 8**FORMULARIO UNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES**

1

SOLICITUD DE:☐ Corrección de Error Material ☒ Modificación a una solicitud

2

SOLICITANTE**Nombre:** MERCK PATENT GMBH

Sociedad constituida y existente bajo las leyes de Alemania.

Dirección: Frankfurter Strasse 250,
64293 Darmstadt,
Alemania**Domicilio:** Darmstadt,
Alemania**Teléfono:** 546 09 70 **Fax:** 249 40 70
E-mail: clientes@cavelier.com**IDENTIFICACION**C.C. ☐ NIT ☐
C.E. ☐ Otro ☐

Número: _____

3

**REPRESENTANTE
O APODERADO****Nombre:** Luz Clemencia de PAEZ**Dirección:** Carrera 4ª No. 72-35**Teléfono:** 347 36 11 **Fax:** 217 92 11**E-mail:** cavelier@cavelier.com**IDENTIFICACION**C.C. ☒ NIT ☐
C.E. ☐ Otro ☐Número: 35.456.344 TP 23.555

4

Número de expediente: 10.053.458

5

Descripción de la corrección o modificación solicitada:

Presento nuevo capítulo reivindicatorio compuesto por 11 reivindicaciones y pido respetuosamente que el examen de patentabilidad sea realizado sobre estas nuevas reivindicaciones presentadas.

Respetuosamente manifiesto que a pesar de eliminar materia del pliego reivindicatorio originalmente presentado, mi representada no renuncia a la protección que pueda obtener sobre dicha materia y se reserva el derecho de presentar una solicitud divisional que la contenga durante el trámite de la presente solicitud, beneficiándose de la fecha de prioridad inicialmente reivindicada.

6

Comprobante de pago No. 11-0093925**Fecha:** 26 de septiembre de 2011

7

Anexos

- ☒ Comprobante de pago de la tasa por \$118.000, por concepto de modificaciones.
- ☐ Comprobante de pago por reivindicaciones adicionales después de la décima reivindicación por.
- ☐ Poderes, si fuere el caso
- ☐ Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.
- ☐ Copia auténtica de la sustitución que del poder otorgado por la Sociedad Solicitante hizo el Doctor EMILIO FERRERO a mi favor, y para lo cual solicito me sea reconocida personería para continuar con el trámite del asunto de la referencia.

8

NOMBRE: LUZ CLEMENCIA DE PAEZ

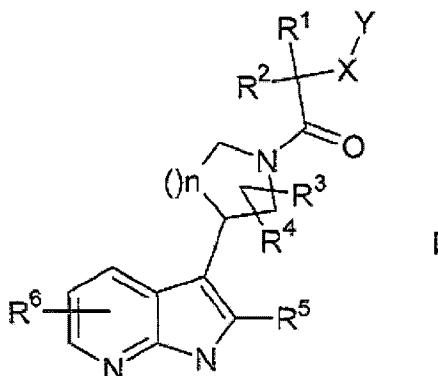
FIRMA: *Luz Clemencia de Paez*

C.C. 35.456.344 de Usaquén T.P.A. 23.555

LLG

Reivindicaciones

1. Compuesto de fórmula 1,



en donde

R^1 y R^2 son independientemente entre sí H, A, cicloalquilo, haloalquilo, Ar, heteroarilo o heterocicloalquilo,

R^3 y R^4 son independientemente entre sí H, A, Hal u OH,

R^5 y R^6 son independientemente entre sí H, A, haloalquilo o Hal,

X es $-(C)_m-$, $-O-$, $-S-$, $-S(O)-$ o $-S(O)_2-$,

Y es A, alcoxialquilo, cicloalquilo, ariloxilo, heteroariloxilo, fenilo o heteroarilo opcionalmente mono, di o trisustituidos por Hal, A, alquilo C_{1-4} , trifluorometilo, trifluorometoxilo, alquilo C_{1-4} , alquilcarbonilo C_{1-4} o alquilo $R^7R^8NC_{1-4}$,

R^7 y R^8 son independientemente entre sí alquilo C_{1-4} o cicloalquilo C_{4-7} ,

n es 1 ó 2 y

m es 0 ó 1,

y las sales, derivados, profármacos, solvatos y estereoisómeros de los mismos fisiológicamente aceptables, incluyendo mezclas de los mismos en todas las proporciones.

2. Compuesto según la reivindicación 1, en el que

R^1 y R^2 son independientemente entre sí H, A, cicloalquilo, haloalquilo, Ar, heteroarilo o heterocicloalquilo,

R^3 y R^4 son independientemente entre sí H, A, Hal u OH,

R^5 y R^6 son independientemente entre sí H, A, haloalquilo o Hal,

X es $-(C)_m-$, $-O-$, $-S-$, $-S(O)-$ o $-S(O)_2-$,

Y es A, alcoxialquilo, cicloalquilo, ariloxilo, heteroariloxilo, fenilo o heteroarilo opcionalmente mono, di o trisustituidos por Hal, A, alquilo C_{1-4} , trifluorometilo, trifluorometoxilo, alquilo C_{1-4} , alquilcarbonilo C_{1-4} o alquilo $R^7R^8NC_{1-4}$,

R^7 y R^8 son independientemente entre sí alquilo C_{1-4} o cicloalquilo C_{4-7} ,

n es 1 y

m es 0 ó 1,

y las sales, derivados, profármacos, solvatos y estereoisómeros de los mismos fisiológicamente aceptables, incluyendo mezclas de los mismos en todas las proporciones.

3. Compuesto según la reivindicación 1, en el que

R^1 y R^2 son independientemente entre sí A, cicloalquilo, haloalquilo, Ar, heteroarilo o heterocicloalquilo,

R^3 y R^4 son independientemente entre sí H, A, Hal u OH,

R^5 y R^6 son independientemente entre sí H, A, haloalquilo o Hal,

X es $-(C)_m-$, $-O-$, $-S-$, $-S(O)-$ o $-S(O)_2-$,

Y es A, alcoxialquilo, cicloalquilo, ariloxilo, heteroariloxilo, fenilo o heteroarilo opcionalmente mono, di o trisustituidos por Hal, A, alquilo C_{1-4} , trifluorometilo, trifluorometoxilo, alquiloxicarbonilo C_{1-4} , alquilcarbonilo C_{1-4} o alquilo $R^7R^8NC_{1-4}$,

R^7 y R^8 son independientemente entre sí alquilo C_{1-4} o cicloalquilo C_{4-7} ,

n es 1 y

m es 0 ó 1,

y las sales, derivados, profármacos, solvatos y estereoisómeros de los mismos fisiológicamente aceptables, incluyendo mezclas de los mismos en todas las proporciones.

4. Compuesto según la reivindicación 1, en el que

R^1 y R^2 son independientemente entre sí A, cicloalquilo, haloalquilo, Ar, heteroarilo o heterocicloalquilo,

R^3 y R^4 son independientemente entre sí H, A, Hal u OH,

R^5 y R^6 son independientemente entre sí H o Hal,

X es $-(C)_m-$, $-O-$, $-S-$, $-S(O)-$ o $-S(O)_2-$,

Y es A, alcoxialquilo, cicloalquilo, ariloxilo, heteroariloxilo, fenilo o heteroarilo opcionalmente mono, di o trisustituidos por Hal, A, alquilo C_{1-4} , trifluorometilo, trifluorometoxilo, alquiloxicarbonilo C_{1-4} , alquilcarbonilo C_{1-4} o alquilo $R^7R^8NC_{1-4}$,

R^7 y R^8 son independientemente entre sí alquilo C_{1-4} o cicloalquilo C_{4-7} ,

n es 1 y

m es 0 ó 1,

y las sales, derivados, profármacos, solvatos y estereoisómeros de los mismos fisiológicamente aceptables, incluyendo mezclas de los mismos en todas las proporciones.

5. Compuesto según la reivindicación 1, en el que

R^1 y R^2 son independientemente entre sí A, cicloalquilo, haloalquilo, Ar, heteroarilo o heterocicloalquilo,

R^3 y R^4 son independientemente entre sí H, A, Hal u OH,

R^5 y R^6 son independientemente entre sí H,

X es $-(C)_m-$,

Y es ariloxilo, heteroariloxilo, fenilo o heteroarilo opcionalmente mono, di o trisustituidos por Hal, A, alquilo C_{1-4} , trifluorometilo, trifluorometoxilo, alquiloxicarbonilo C_{1-4} , alquilcarbonilo C_{1-4} , o alquilo $R^7R^8NC_{1-4}$,

R^7 y R^8 son independientemente entre sí alquilo C_{1-4} o cicloalquilo C_{4-7} ,

n es 1 y

m es 0 ó 1,

y las sales, derivados, profármacos, solvatos y estereoisómeros de los mismos fisiológicamente aceptables, incluyendo mezclas de los mismos en todas las proporciones.

6. Compuesto según la reivindicación 1, en el que

R¹ y R² son independientemente entre sí H, A, cicloalquilo, haloalquilo, Ar, heteroarilo o heterocicloalquilo,

R³ y R⁴ son independientemente entre sí H, A, Hal u OH,

R⁵ y R⁶ son independientemente entre sí H, A, haloalquilo o Hal,

X es -(C)_m-, -O-, -S-, -S(O)- o -S(O)₂-,

Y es A, alcoxilquilo, cicloalquilo, ariloxilo, heteroariloxilo, fenilo o heteroarilo opcionalmente mono, di o trisustituidos por Hal, A, alquioxilo C₁₋₄, trifluorometilo, trifluorometoxilo, alquiloxycarbonilo C₁₋₄, alquilcarbonilo C₁₋₄ o alquioxilo R⁷R⁸NC₁₋₄

R⁷ y R⁸ son independientemente entre sí alquilo C₁₋₄ o cicloalquilo C₄₋₇,

n es 2 y

m es 0 ó 1,

y las sales, derivados, profármacos, solvatos y estereoisómeros de los mismos fisiológicamente aceptables, incluyendo mezclas de los mismos en todas las proporciones.

7. Compuesto seleccionado entre el grupo compuesto por:

- a) (2-fluorofenil)-[3-(1H-pirrolo[2,3-b]piridin-3-il)-pirrolidin-1-il]-metanona
- b) (4-metoxi-2-metifenil)-[3-(1H-pirrolo[2,3-b]piridin-3-il)-pirrolidin-1-il]-metanona
- c) (Ciclohexil)-[3-(1H-pirrolo[2,3-b]piridin-3-il)-pirrolidin-1-il]-metanona
- d) (Piridin-3-il)-[3-(1H-pirrolo[2,3-b]piridin-3-il)-pirrolidin-il]-metanona
- e) [3-(1H-pirrolo[2,3-b]piridin-3-il)-pirrolidin-1-il]-o-tolil-metanona
- f) (2-metil-2-fenil-1)-[3-(1H-pirrolo[2,3-b]piridin-3-il)-pirrolidin-1-il]-propan-1-ona
- g) 4-dimetilaminofenil-[3-(1H-pirrolo[2,3-b]piridin-3-il)-pirrolidin-1-il]metanona
- h) (1-Fenil-ciclopropil)-[3-(1H-pirrolo[2,3-b]piridin-3-il)-pirrolidin-1-il]-metanona
- i) 2-(4-cloro-fenil)-2-metil-1-[3-(1H-pirrolo[2,3-b]piridin-3-il)-pirrolidin-1-il]-propan-1-ona
- j) 2-metil-2-fenoxi-1-[3-(1H-pirrolo[2,3-b]piridin-3-il)-pirrolidin-1-il]-propan-1-ona
- k) (1-(4-cloro-fenil)ciclobutil)-[3-(1H-pirrolo[2,3-b]piridin-3-il)-pirrolidin-1-il]-metanona
- l) 2-(4-cloro-fenoxi)-2-metil-1-[4-(1H-pirrolo[2,3-b]piridin-3-il)-piperidin-1-il]-propan-1-ona
- m) 2-metil-1-[4-(1H-pirrolo[2,3-b]piridin-3-il)-piperidin-1-il]-2-[4-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-piperazin-1-il]-propan-1-ona
- n) 4-(4-fluoro-fenoxi)-3,3-dimetil-1-[4-(1H-pirrolo[2,3-b]piridin-3-il)-piperidin-1-il]-butan-1-ona
- o) 2-(4-cloro-fenil)-2-metil-1-[4-(1H-pirrolo[2,3-b]piridin-3-il)-piperidin-1-il]-propan-1-ona
- p) [1-(4-cloro-fenil)-ciclopropil]-[4-(1H-pirrolo[2,3-b]piridin-3-il)-piperidin-1-il]-metanona
- q) 4-(4-fluoro-fenoxi)-3,3-dimetil-1-[3-(1H-pirrolo[2,3-b]piridin-3-il)-pirrolidin-1-il]-butan-1-ona
- r) 1-(4-fluoro-fenoxi)-ciclopropil-[3-(1H-pirrolo[2,3-b]piridin-3-il)-pirrolidin-1-il]-metanona
- s) [1-(4-cloro-fenil)-ciclopropil]-[3-(1H-pirrolo[2,3-b]piridin-3-il)-piperidin-1-il]-metanona

t) 2-(4-cloro-bencenosulfonil)-1-[3-(1*H*-pirrolo[2,3-*b*]piridin-3-il)-pirrolidin-1-il]-etanona
y las sales, derivados, profármacos, solvatos y estereoisómeros de los mismos
fisiológicamente aceptables, incluyendo mezclas de los mismos en todas las proporciones.

8. Método para la preparación de un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 7,
caracterizado por

a) un azaindol de fórmula II, donde R^5 y R^6 son como se definió anteriormente, se formula
para obtener el aldehído de fórmula III, en donde R^5 y R^6 son como se definió anteriormente,
dicho aldehído de fórmula III se hace reaccionar con cianoacetato de etilo seguido de la
adición de Michael de cianuro, ciclación ácida y reducción con hidruro para obtener un
pirrolidin-azaindol de fórmula IV, en donde R^5 y R^6 son como se definió anteriormente; la
acilación de dicho pirrolidin-azaindol de fórmula IV, en donde R^5 y R^6 son como se definió
anteriormente con ácido carboxílico activado de fórmula V, donde R^1 , R^2 , X e Y son como se
definió anteriormente, para obtener el compuesto de fórmula I, donde R^1 , R^2 , R^5 , R^6 , X e Y son
como se define anteriormente,

b) un azaindol de fórmula II, en donde R^5 y R^6 son como se definió anteriormente, se
condensa con una bromo-maleimida de fórmula VI para obtener la pirrolidindiona de fórmula
VII, en donde R^5 y R^6 son como se definió anteriormente, la hidrogenación de dicha
pirrolidindiona de fórmula VII seguida sucesivamente de desprotección bencílica y reducción
con hidruro produce un pirrolidin-azaindol de fórmula IV, en donde R^5 y R^6 son como se definió
anteriormente, se realiza la acilación de dicho pirrolidin-azaindol de fórmula IV, en donde R^5 y
 R^6 son como se definió anteriormente, con ácido carboxílico activado de fórmula V, donde R^1 ,
 R^2 , X e Y son como se definió anteriormente, para obtener el compuesto de fórmula I, donde
 R^1 , R^2 , R^5 , R^6 , X e Y son como se define anteriormente,

c) un azaindol de fórmula II, en donde R^5 y R^6 son como se definió anteriormente, se
hace reaccionar en medio básico con una cetona de fórmula VIII, en donde R^3 , R^4 y n son
como se definió anteriormente, para obtener una mezcla de olefinas de fórmulas IX y X, en
donde R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y n son como se definió anteriormente, la hidrogenación de dichas
olefinas de fórmulas IX y X en donde R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y n son como se definió anteriormente,
seguida de la desprotección del grupo Boc produjo un pirrolidin-azaindol de fórmula XI, en
donde R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y n son como se definió anteriormente, la acilación de dicho pirrolidin-
azaindol de fórmula XI, en donde R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y n son como se definió anteriormente, se
hace reaccionar con ácido carboxílico activado de fórmula V, donde R^1 , R^2 , X e Y son como se
definió anteriormente, para obtener el compuesto de fórmula I en donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 ,
X e Y son como se definió anteriormente,

d) un resto X, Y, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 y/o R^8 según se define en la reivindicación 1,
se convierte en otro resto X, Y, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 y/o R^8 , p. ej, mediante la introducción
de un grupo alquilo, o

e) un compuesto de fórmula I se aísla y/o trata con un ácido o base, para obtener la sal
del mismo.

9. Composición farmacéutica caracterizada porque contiene una cantidad terapéuticamente eficaz de uno o más compuestos según una de las reivindicaciones 1 a 7.

10. Composición farmacéutica según la reivindicación 9, caracterizada porque contiene uno o más compuestos adicionales, seleccionados entre el grupo compuesto por excipientes, auxiliares, adyuvantes, diluyentes y vehículos fisiológicamente aceptables y principios farmacéuticamente activos distintos a los compuestos según una de las reivindicaciones 1 a 7.

11. Proceso para la fabricación de una composición farmacéutica, caracterizado porque uno o más compuestos según una de las reivindicaciones 1 a 7 y uno o más compuestos seleccionados entre el grupo compuesto por excipientes, auxiliares, adyuvantes, diluyentes y vehículos sólidos, líquidos o semilíquidos y principios farmacéuticamente activos distintos a los compuestos según una de las reivindicaciones 1 a 7, se convierten en una forma de dosificación adecuada.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800.176.089-2

- / -



RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0091483

Bogotá D.C., Septiembre 16 de 2011 - 16:39:15

RECIBIDO DE : CAVELIER ABOGADOS

NI 860.041.367

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	411768221	16/09/2011	39.000.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr. UNDITARIO	Vr. CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICACIONES EN CREACION CORRECCION A SOLICITUD EN TRAMITE / MODIFICA	118.000.00	118.000.00
				\$118.000.00

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

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-053458- -00004-0000

Fecha: 2011-09-29 11:32:00 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTE IYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 8

COLO: 09266-841-0217

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) 5870284 Linea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

Septiembre 16 de 2011 - 16:39:24