



No. 10-061149- -00010-0000

Fecha: 2013-11-15 17:42:52 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 11

DELEGATURA PROPIEDAD INDUSTRIAL
INSCRIPCIÓN DE AFECTACIONES

P2010/000068

1. Datos del Signo o Nueva Creación

☒ Patente ☐ Marca ☐ Lema ☐ Nombre comercial/enseña ☐ Diseño ☐ Esquema de trazado de circuito
☐ Denominación de Origen ☐ Patente de Modelo de utilidad

1.1. Identificación:

No. DE CERTIFICADO	VIGENCIA	NUMERO DE EXPEDIENTE
	08/11/2028	10-061.149

NOTA: Si el espacio anterior no es suficiente, por favor relacione los datos de los demás signos/nuevas creaciones con respecto de los que se solicita la inscripción de la afectación correspondiente en hoja anexa, o utilice un formulario sustancialmente igual a este

2. Datos del titular

☐ Persona Natural ☒ Persona Jurídica

BAYER PHARMA AKTIENGESELLSCHAFT y ASTRAZENECA AB

Nombre o denominación /Nombre Social

WALTER KLOSE y NOESKE-JUNGBLUT

Nombre del representante

Tipo de empresa ☐ Micro ☐ Pequeña ☐ Mediana ☒ Otra

Documento de identificación: C.C. ☐ C.E. ☐ NIT ☐ Otro ☐ Número

Nacionalidad/País de constitución	Dirección del titular	
Alemania	Muellerstrasse 178, 13353, Berlín, Alemania	Berlín
Suecia	9 - S-151 85 Södertälje, Suecia	Södertälje

3. Datos del apoderado:

OLARTE GARCIA CARLOS R.

79.782.747 de Bogotá

74.295

Apellidos y Nombre

Documento de identificación

Tarjeta profesional

Dirección del representante		
Carrera 5 No. 34-03		
Dirección electrónica	No. Fax	Número telefónico
office@olartemoure.com	6017799	6017700

Número de Radicación o Protocolo de poder general:

☒

Autorizo expresamente a la Superintendencia de Industria y Comercio para que todas las comunicaciones sean enviadas a través de la dirección de correo electrónico.

4. Cambio de nombre, domicilio o dirección

☐

Cambio de Nombre

☐

Cambio de domicilio

☐

Cambio de dirección

De:

Tal como aparece actualmente en el registro

A:

Nacionalidad/País de constitución	Dirección y domicilio		
Södertälje	9 –S – 151 85 Södertälje , Sweden.		
Dirección electrónica	No. Fax	Número telefónico	
office@olartemoure.com	6017799	6017700	

5. Otras inscripciones

5.

☐

Prenda

☐

Embargo

☐

Medidas cautelares

Código postal	Dirección electrónica	No. Fax	Número telefónico

NOTA: Si el espacio anterior no es suficiente, por favor relacione las afectaciones con respecto de las que se solicita inscripción en hoja anexa, o utilice un formulario sustancialmente igual a este.

6. Modificación ó Limitación a Reivindicaciones (art. 70 Decisión 486)

Se insertan las nuevas Reivindicaciones 13 a 16, las cuales encuentran soporte en las Ejemplos: 4, 5, 7 y 8 del Capítulo Descriptivo respectivamente.

Comprobante de pago No. Fecha

7. Anexos

☒

Comprobante de pago de la tasa de Modificaciones posteriores a la Concesión \$505.000

☐

Poder, si fuere el caso con el que se acredita la representación. Capítulo Reivindicatorio Modificado.

☐

Copia de la solicitud con sus anexos en medio magnético.

8. Firma (s)

Nombre del Firmante
CARLOS R. OLARTE

C.C 79.782.747 de Bogotá

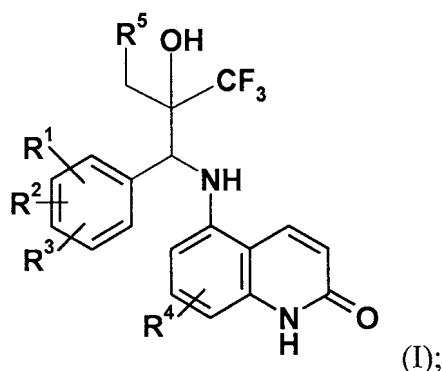
Firma

Tarjeta Profesional 74.295

CAPITULO REIVINDICATORIO MODIFICADO

(Modificaciones Voluntarias Posteriores a la Concesión)

1. Compuestos caracterizados porque responden a la fórmula general (I)



donde R^4 es un sustituyente 7-fluoro;

donde R^1 , R^2 y R^3 son independientemente hidrógeno, fluoro, cloro, bromo ciano, metoxi, etoxi e hidroxilo, donde al menos uno de R^1 , R^2 y R^3 se selecciona del grupo formado por cloro, fluor y metoxi;

R^5 se selecciona del grupo formado por $S-CH_2-CH_3$, $S-CH_3$, $-O-CH_2-CH_3$, $-O-CH_3$, $-OH$ y Cl ;

y sus sales.

2. Compuestos de acuerdo con la Reivindicación 1, caracterizados porque se seleccionan de la lista que consiste en

5-{{1-(2-cloro-3-fluoro-4-metoxifenil)-3,3,3-trifluoro-2-hidroxi-2-([metilsulfanil]metil)propil]amino}-7-fluoro-1H-quinolin-2-ona;

5-{{1-(2-cloro-3-fluoro-4-metoxifenil)-2-([etilsulfanil]metil)-3,3,3-trifluoro-2-hidroxi-2-propil]amino}-7-fluoro-1H-quinolin-2-ona;

5-{{1-(2-cloro-3-fluoro-4-metoxifenil)-3,3,3-trifluoro-2-hidroxi-2-(metoximetil)propil]amino}-7-fluoro-1H-quinolin-2-ona;

5-{{1-(4-cloro-3-fluoro-2-metoxifenil)-2-(etoximetil)-3,3,3-trifluoro-2-hidroxi-2-propil]amino}-7-fluoro-1H-quinolin-2-ona;

5-{{1-(2-cloro-3-fluoro-4-metoxifenil)-3,3,3-trifluoro-2-hidroxi-2-(hidroximetil)propil]amino}-7-fluoro-1H-quinolin-2-ona;

5-{{1-(5-cloro-3-fluoro-2-metoxifenil)-3,3,3-trifluoro-2-hidroxi-2-(hidroximetil)-propil]amino}-7-fluoro-1H-quinolin-2-ona;

5-{{1-(5-cloro-3-fluoro-2-metoxifenil)-2-(clorometil)-3,3,3-trifluoro-2-hidroxi-2-propil]amino}-7-fluoro-1H-quinolin-2-ona;

5-{{1-(4-cloro-3-fluoro-2-metoxifenil)-3,3,3-trifluoro-2-hidroxi-2-

(metoximetil)propil]amino}-7-fluoro-1H-quinolin-2-ona;

5-{[1-(2-cloro-3-fluoro-4-metoxifenil)-2-(etoximetil)-3,3,3-trifluoro-2-hidroxipropil]amino}-7-fluoro-1H-quinolin-2-ona;

5-{[1-(2-cloro-3-fluoro-4-hidroxifenil)-3,3,3-trifluoro-2-hidroxi-2-(hidroximetil)propil]amino}-7-fluoro-1H-quinolin-2-ona;

y sus sales.

3. Compuestos enantioméricamente puros de acuerdo con la Reivindicación 1, caracterizados porque se seleccionan de la lista que consiste en

5-{(1S,2R)[1-(2-fluoro-4-metoxifenil)-3,3,3-trifluoro-2-hidroxi-2-([metilsulfanil]metil)propil]amino}-7-fluoro-1H-quinolin-2-ona;

5-{(1S,2R)[1-(2-cloro-3-fluoro-4-metoxifenil)-2-([etilsulfanil]metil)-3,3,3-trifluoro-2-hidroxipropil]amino}-7-fluoro-1H-quinolin-2-ona;

5-{(1S,2S)[1-(2-cloro-3-fluoro-4-metoxifenil)-3,3,3-trifluoro-2-hidroxi-2-(metoximetil)propil]amino}-7-fluoro-1H-quinolin-2-ona;

5-{(1S,2S)[1-(2-cloro-3-fluoro-4-metoxifenil)-2-(etoximetil)-3,3,3-trifluoro-2-hidroxipropil]amino}-7-fluoro-1H-quinolin-2-ona;

5-{(1S,2S)[1-(2-cloro-3-fluoro-4-metoxifenil)-3,3,3-trifluoro-2-hidroxi-2-(hidroximetil)propil]amino}-7-fluoro-1H-quinolin-2-ona;

5-{(1S,2S)[1-(5-cloro-3-fluoro-2-metoxifenil)-3,3,3-trifluoro-2-hidroxi-2-(hidroximetil)propil]amino}-7-fluoro-1H-quinolin-2-ona;

5-{(1S,2R)[1-(5-cloro-3-fluoro-2-metoxifenil)-2-(clorometil)-3,3,3-trifluoro-2-hidroxipropil]amino}-7-fluoro-1H-quinolin-2-ona;

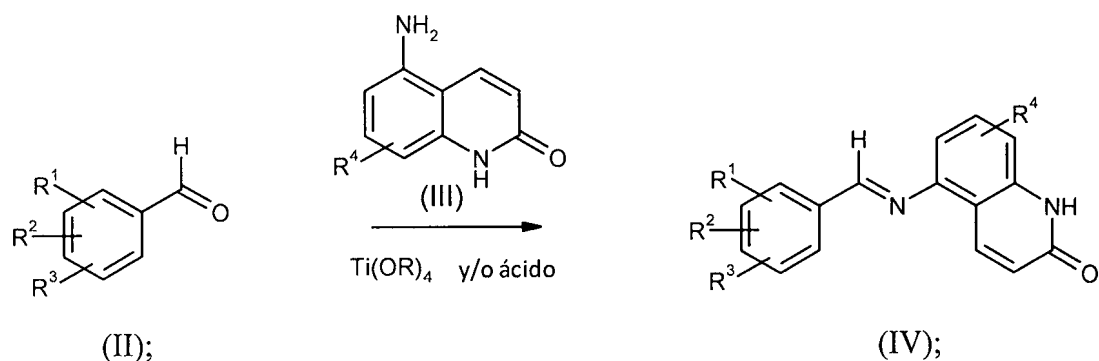
5-{[(1S,2S)[1-(2-cloro-3-fluoro-4-hidroxifenil)-3,3,3-trifluoro-2-hidroxi-2-(hidroximetil)propil]amino}-7-fluoro-1H-quinolin-2-ona;

y sus sales.

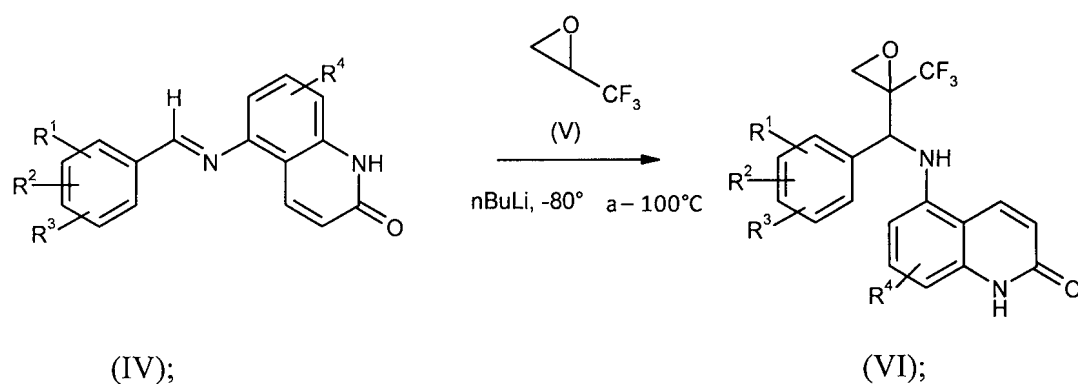
4. Una composición farmacéutica caracterizada porque comprende un compuesto de Fórmula (I) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo según se define en las Reivindicaciones 1 a 3, y un adyuvante, diluyente o vehículo farmacéuticamente aceptable.

5. Proceso para la fabricación de los compuestos de Fórmula general I de acuerdo con la Reivindicación 1, caracterizado porque se llevan a cabo los siguientes pasos:

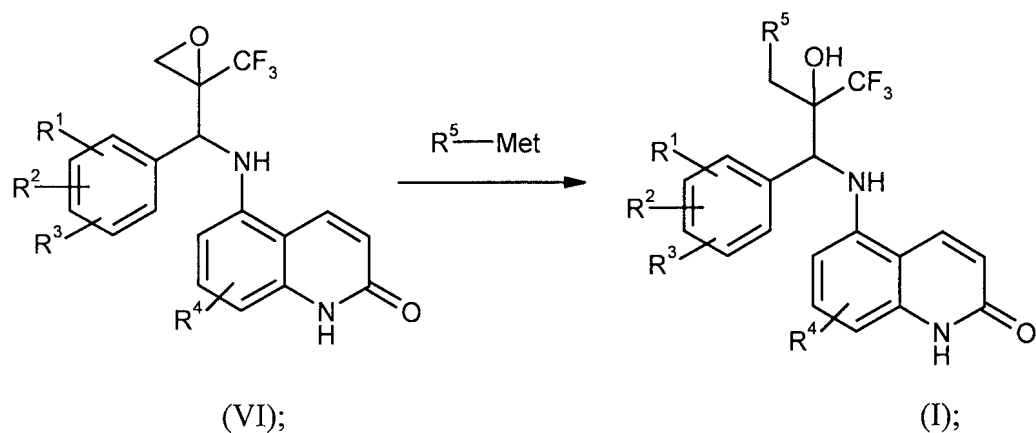
paso a):



paso b):

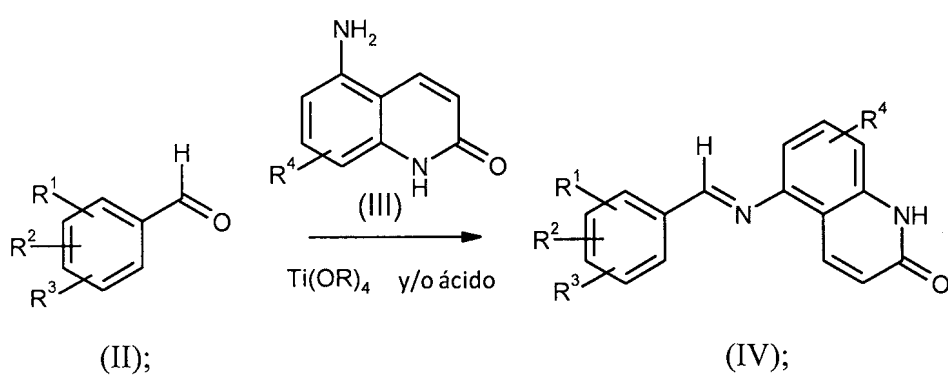


paso c):



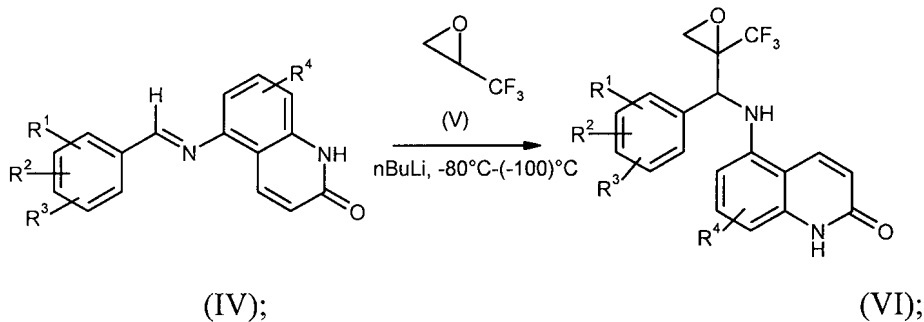
en donde todos los residuos tienen las definiciones según se dieron en la Reivindicación 1 y R es C₁-C₄-alquilo y Met significa metales alcalinos, metales alcalinotérreos, aluminio, cobre, silicio o estaño.

6. El proceso para la fabricación de los compuestos de Fórmula general I de acuerdo con la Reivindicación 5, caracterizado porque en el paso a) los benzaldehídos de Fórmula general II se hacen reaccionar con aminoquinolonas sustituidas de Fórmula III para dar iminas de Fórmula general IV en presencia de ácidos de Lewis y/o bajo condiciones ácidas,



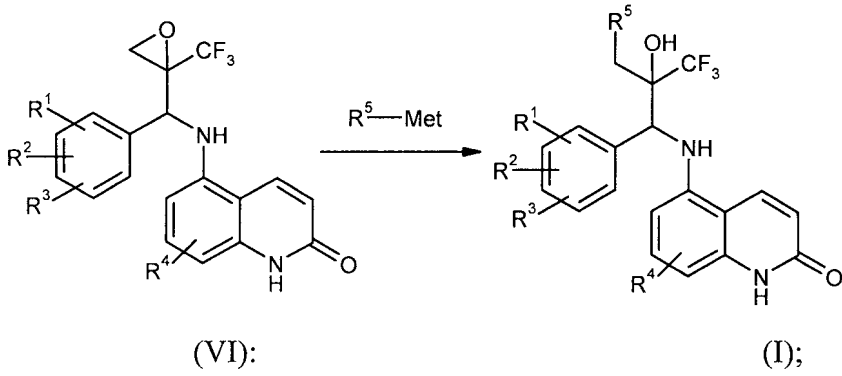
en donde R^1 , R^2 , R^3 y R^4 tienen los significados que se dieron en la reivindicación 1 y R es C_1 - C_4 -alquilo.

7. El proceso para la fabricación de los compuestos de Fórmula general I de acuerdo con la Reivindicación 5, caracterizado porque en el paso b) se hace reaccionar trifluoroepoxipropano V metalizado, opcionalmente en su forma enantioméricamente pura, con iminas de fórmula IV a bajas temperaturas para dar epóxidos de fórmula general VI:



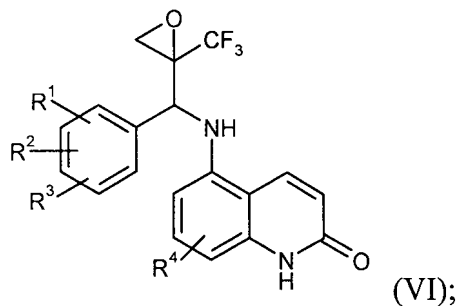
en donde R^1 , R^2 , R^3 y R^4 tienen los significados que se dieron en la Reivindicación 1 y en forma opcional se lleva a cabo una separación subsiguiente de los diastereoisómeros.

8. El proceso para la fabricación de los compuestos de Fórmula general I de acuerdo con la Reivindicación 5, caracterizado porque en el paso c) se hacen reaccionar los epóxidos de Fórmula general VI opcionalmente en su forma enantioméricamente pura con compuestos de fórmula general R^5 -Met en donde Met significa metales alcalinos, metales alcalinotérreos, aluminio, cobre, silicio o estaño y R^5 tiene las definiciones que se dieron en la Reivindicación 1, en presencia de ácidos de Lewis, o los mismos se abren directamente mediante cianuros, aminas, alcoholes, tioalcoholes, halogenuros y/o agua en presencia de bases o ácidos próticos fuertes, para dar compuestos de Fórmula general I:



en donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 tienen los significados que se dieron en la Reivindicación 1 y en forma opcional se lleva a cabo una separación subsiguiente de los diastereoisómeros.

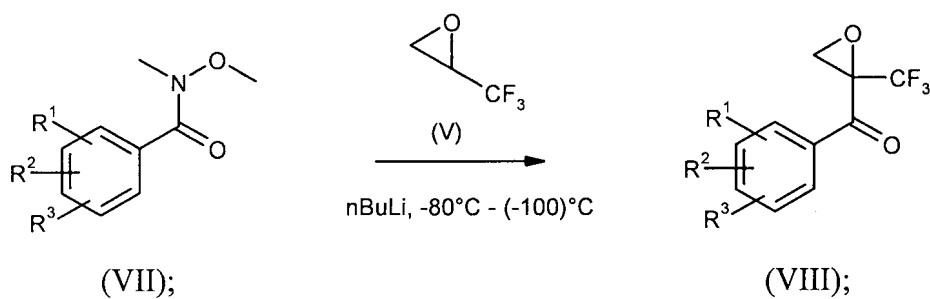
9. Compuestos intermediarios, caracterizados porque poseen la Fórmula general VI,



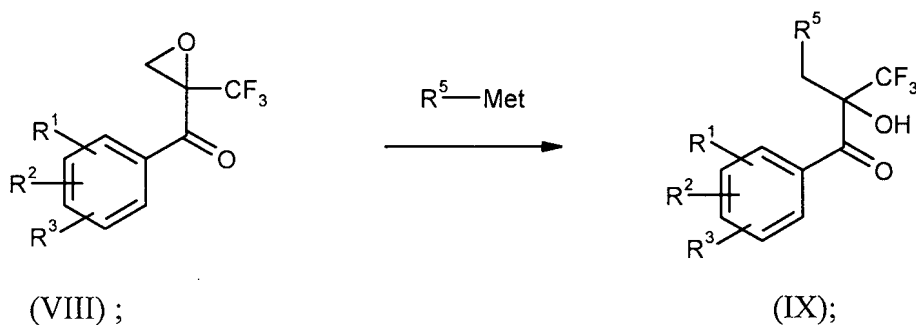
en la forma de una mezcla racémica o como el compuesto enantioméricamente puro.

10. Un proceso para la fabricación de los compuestos de fórmula general I de acuerdo con la Reivindicación 1, caracterizado porque se llevan a cabo los siguientes pasos:

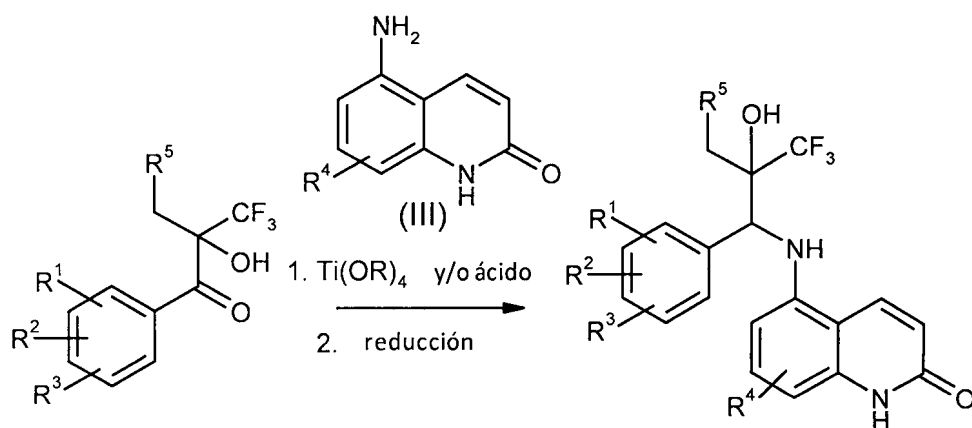
paso a):



paso b):



paso c):



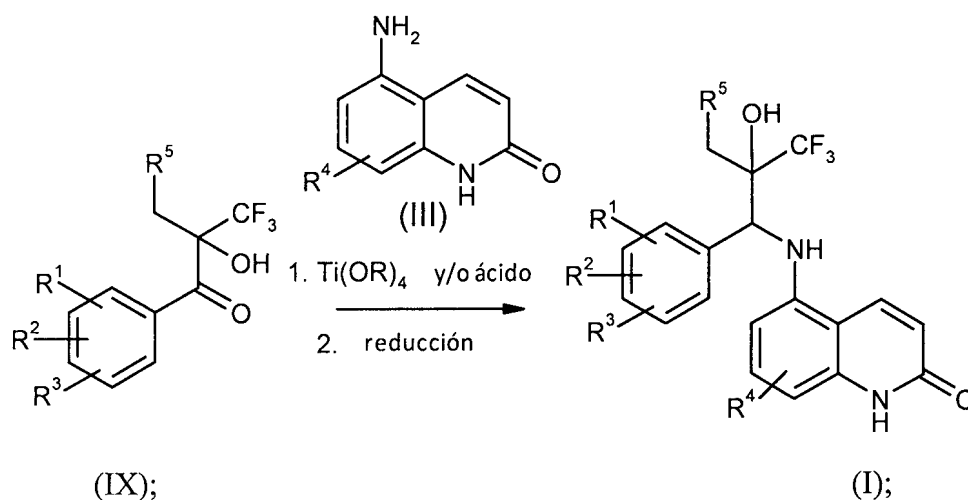


(IX);

(I);

en donde todos los residuos tienen el significado según se definieron en la Reivindicación 1, Met significa metales alcalinos, metales alcalinotérreos, aluminio, cobre, silicio o estaño y R es C₁-C₄-alquilo.

11. El proceso para la fabricación de los compuestos de Fórmula general I de acuerdo con la Reivindicación 10, caracterizado porque en el paso c) se pueden condensar cetonas del tipo (IX), opcionalmente en su forma enantioméricamente pura, con aminoquinolonas sustituidas del tipo (III) para dar iminas y subsiguientemente o simultáneamente se pueden reducir para dar compuestos de fórmula I:



en donde R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ tienen los significados dados en la Reivindicación 1 y R como se definió en la Reivindicación 12, y opcionalmente se puede llevar a cabo una separación subsiguiente de los diastereoisómeros.

12. Una combinación farmacéutica caracterizada porque comprende un compuesto de Fórmula (I), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, y uno o más agentes seleccionados de la lista que comprende:

- un inhibidor de PDE4, que incluye un inhibidor de la isoforma PDE4D;
- un agonista selectivo del adrenoceptor beta sub2;
- un antagonista del receptor muscarínico;
- un modulador de la función del receptor de quimioquina; o
- un inhibidor de la función de la quinasa p38.

13. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, caracterizado porque es 5-{[1-(2-Cloro-3-fluoro-4-metoxifenil)-2([etilsulfanil]metil)-3,3,3-trifluoro-2-hidroxipropil]amino}-7-fluoro-1H-quinolin-2-ona.

14. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, caracterizado porque es 5-{[1-

(2-Cloro-3-fluoro-4-metoxifenil)-3,3,3-trifluoro-2-hidroxi-2-(metoximetil)propil]amino}-7-fluoro-1H-quinolin-2-ona.

15. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, caracterizado porque es 5-{[1-(2-Cloro-3-fluoro-4-metoxifenil)-3,3,3-trifluoro-2-hidroxi-2-(hidroximetil)propil]amino}-7-fluoro-1H-quinolin-2-ona.

16. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, caracterizado porque es 5-{[1-(5-Cloro-3-fluoro-2-metoxifenil)-3,3,3-trifluoro-2-hidroxi-2-(hidroximetil)-propil]amino}-7-fluoro-1H-quinolin-2-ona.

ANEXO EXPLICATIVO DE LAS MODIFICACIONES

Se insertan las nuevas Reivindicaciones 13 a 16, las cuales encuentran soporte en los Ejemplos: 4, 5,7 y 8 del Capítulo Descriptivo respectivamente.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -

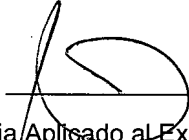
 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA	RECIBO DE CAJA	No. 13 - 106116
		Bogotá D.C., Octubre 21 de 2013 - 14:59:54

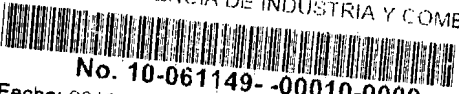
RECIBIDO DE : OLARTE MOURE & ASOCIADOS NI 830.122.870

*** Soporte del Pago ***					
TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
RECIBO DE CA	999999999	88910	06/09/2013		505.000.00

*** Conceptos Pagados ***			
CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr. UNIDITARIO Vr. CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	114 PTC CAP-II EXAMEN DE PATENTIBILIDAD DE INVENION	505.000.00 505.000.00
			<u>\$505.000.00</u>
			=====

SON: **QUINIENTOS CINCO MIL PESOS MONEDA CORRIENTE**

Responsable:  _____
Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 10-061149- -00010-0000
Fecha: 2013-11-15 17:42:52 Dep. 2020 DIR. NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 11