



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 10-098749- -00005-0000

Fecha: 2012-08-27 16:35:13 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 18

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

MODIFICACIONES Y/O CORRECCIONES

1. Identificación del Tramite

- ☐ Error material
- ☒ Modificación a una Solicitud en trámite
- ☒ Patente de Invención
- ☐ Patente de Modelo de Utilidad
- ☐ Registro de Diseño Industrial
- ☐ Esquema de Trazado de Circuitos Integrados

2. Datos del solicitante

Persona Natural ☐

Persona Jurídica ☒

NATCO PHARMA LIMITED

Nombre o denominación / Nombre o razón social completa

Nombre representante legal

Tipo de empresa Micro ☐ Pequeña ☐ Mediana ☐ Otra ☐

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

Nacionalidad/País de constitución	Dirección y domicilio del titular	Ciudad
India	Natco House, Road No. 2, Banjara Hills, Hyderabad 500 033,	Andhra Pradesh
Dirección electrónica		No. Fax
clientes@cavelier.com		2 11 86 50
		Número telefónico
		3 47 36 11

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

3. Datos del apoderado:

Apellidos y Nombre Documento de identificación Tarjeta profesional

De Páez Luz Clemencia C.C. 35.456.344 T.P.A. 23.555

Dirección y domicilio		Ciudad
Carrera 4ª No. 72 –35		Bogotá
Dirección electrónica		No. Fax
cavelier@cavelier.com		2 11 86 50
		Número telefónico
		3 47 36 11
En caso de haber presentado poder general para asuntos que se adelanten ante la Delegatura de Propiedad Industrial, sírvase indicar el número de su radicación o protocolo de poder general		

4. Datos del trámite

Corrección:

Expediente No 10.098.749

Aparece

Debe ser

Modificación:**Modificación al capítulo reivindicatorio.**

Presento nuevo capítulo reivindicatorio compuesto por 7 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 además 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.

**Modificación al capítulo descriptivo.****Modificación al resumen.****Modificación a los dibujos.****Modificación al solicitante.****5. Anexos**

Comprobante de pago de la tasa para la presentación de la corrección y/o modificación.



Poder, si fuere el caso.



Documento que contiene las modificaciones o correcciones.



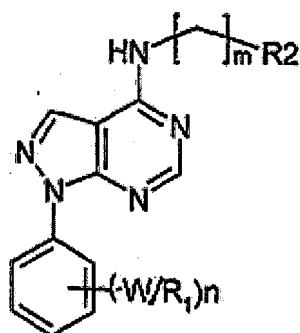
Copia de la solicitud y sus anexos en formato magnético.

6. Firma	
Nombre y apellidos	Firma
LUZ CLEMENCIA DE PAEZ	<i>Luz Clemencia De Paez</i>
C.C. 35.456.344 DE Usaquén	Tarjeta Profesional 23.555

JP SCT\SDC\AF224077\WPC17766

REIVINDICACIONES MODIFICADAS

1. Derivados de pirazolo[3,4-d]pirimidina sustituida de la fórmula I,



Fórmula-I

y sales farmacéuticamente aceptables de los mismos, caracterizados porque

n y m son 1, 2 ó 3;

W es un enlace individual, alquenilo, alquinilo, NH, S, SO, SO₂, O, C=O, o un grupo amida:

cada R₁ se selecciona independientemente de hidrógeno, halo, hidroxilo, amino, hidroxiamino, carboxi, nitro, guanidino, ureido, carbamoilo, ciano y trifluorometilo,

o cada R₁ se selecciona independientemente del grupo que consiste de C₃-C₆cicloalquilo, C₁-C₆alcoxi, C₃-C₆cicloalcoxi, (C₁-C₆)alcoxycarbonilo, ariloxi, heteroariloxi, C₁-C₆tioalcoxi, C₃-C₆tioalcoxi, tioariloxi, tioheteroariloxi, nitro, amino, N-mono(C₁-C₆)alquilamino, N,N-di(C₁-C₆)alquilamino, formamido, amido, acetamido, hidroxilamino, C₁-C₆alcoxiamino, hidrazino, trifluorometilo, trifluorometoxi, C₂-C₆alquenilo, C₂-C₆alquinilo, arilo, heterociclilo, arilo fusionado, heteroarilo fusionado y heterociclilo fusionado; o

cada R₁ se selecciona independientemente de R₃-sulfonilamino, ftalimido-(C₁-C₄)-alquilsulfonilamino, benzamido, bencenosulfonilamino, 3-fenilureido, 2-oxopirrolidin-1-ilo, 2,5-dioxopirrolidin-1-ilo, y C₂-C₄alcanoilamino, y en donde el sustituyente bencenosulfonilamino o fenilo o fenoxi o anilino o fenilsulfanilo en R¹ puede tener opcionalmente uno o dos halógenos, (C₁-C₄)alquilo, ciano, metanosulfonilo o sustituyentes (C₁-C₄)alcoxi, o cualquiera de dos R₁ tomados conjuntamente con los carbonos a los cuales están unidos comprende un anillo de 5-8 miembros que comprende al menos uno o dos heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno; en donde los grupos alquilo y porciones alquilo de los grupos alcoxi o alquilamino en R₁ pueden ser de cadena recta o si comprenden al menos tres carbonos pueden estar ramificados o ser cíclicos y en donde R₃ se selecciona de C₁-C₆alquilo y C₃-C₆cicloalquilo;

R₂ se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, C₁-C₆alquilo, C₃-C₆cicloalquilo, C₁-C₆alcóxicarbonilo, arilo, heteroarilo, C₁-C₆tioalquilo, trifluorometilo, trifluorometoxi, heterociclilo, arilo fusionado, heteroarilo fusionado y heterociclilo fusionado, tal como 1,3-benzodioxol y 1,4-benzodioxina,

o R₂ se selecciona del grupo que consiste de fenilo o bencilo y sustituido con 1, 2, 3 ó 4 grupos y los sustituyentes se seleccionan independientemente de R₄,

o R₂ es seleccionado de -O(CH₂)₂OCH₃ y -CO₂H,

en donde R₄ se selecciona de hidrógeno, halo, hidroxilo, amino, hidroxiamino, carboxi, nitro, guanidino, ureido, carbamoilo, ciano, trifluorometilo, C₁-C₆alquilo, C₃-C₆cicloalquilo, hidroxilo, C₁-C₆alcoxi, C₃-C₆cicloalcoxi, C₁-C₆alcóxicarbonilo, ariloxi, heteroariloxi, C₁-C₆tioalcoxi, C₃-C₆tioalcoxi, tioariloxi, tioheteroariloxi, nitro, amino, N-mono(C₁-C₆)alquilamino, N,N-di(C₁-C₆)alquilamino, formamido, amido, acetamido, hidroxilamino, C₁-C₆alcóxiamino, hidrazino, trifluorometilo, trifluorometoxi, alqueno, alquino, arilo, heterociclilo, arilo fusionado, heteroarilo fusionado, heterociclilo fusionado, -O(CH₂)₃-morfolino y -O(CH₂)₂OCH₃ o un derivado del mismo comprendiendo un grupo 3,5-dimetilfenil o (trimetilsilil)etilfenil en el átomo de nitrógeno sustituido del grupo pirazolo en la fórmula I.

2. Derivados de pirazolo[3,4-d]pirimidina de la Fórmula I de conformidad con la reivindicación 1, caracterizados porque se seleccionan de:

A) Derivados de [1-(3-etinil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina

- a) N-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metil)-[1-(3-etinil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4-il]-amina
- b) [2-(2-metoxi-etoxi)-etil]-[1-(3-etinil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4-il]-amina
- c) [4-metoxi-3-(3-morfolin-4-il-propoxi)-bencil]-[1-(3-etinil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4-il]-amina
- d) (3,4-dimetoxi-bencil)-[1-(3-etinil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4-il]-amina
- e) [3,4-bis-(2-metoxi-etoxi)-bencil]-[1-(3-etinil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4-il]-amina
- f) Benzo[1,3]dioxol-5-il-metil-[1-(3-etinil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4-il]-amina

- g) Ácido [1-(3-etinil-fenil)-1H-pirazol[3,4-d]pirimidina-4ilamino)-acético
- h) 3,4-dietoxi-bencil-[1-(3-etinil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il-amina
- i) [1-(3-etinil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-(3,4,5-trimetoxi-bencil)-amina
- j) [4-(2-metoxi-etoxi)-bencil]-[1-(3-etinil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-amina
- k) (4-metoxi-bencil-[1-(3-etinil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-amina
- l) [4-(3-morfolin-4-il-propoxi)-bencil]-[1-(3-etinil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-amina

B) Derivados de [1-(3-trimetilsilaniletinil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina

- a) N-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metil)-[1-(3-trimetilsilaniletinil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il-amina
- b) [2-(2-metoxi-etoxi)-etil]-[1-(3-trimetilsilaniletinil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-amina
- c) [4-metoxi-3-(3-morfolin-4-il-propoxi)-bencil]-[1-(3-trimetilsilaniletinil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-amina
- d) (3,4-dimetoxi-bencil)-[1-(3-trimetilsilaniletinil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-amina
- e) [3,4-bis-(2-metoxi-etoxi)-bencil]-[1-(3-trimetilsilaniletinil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-amina
- f) Benzo[1,3]dioxol-5-il-metil-[1-(3-trimetilsilaniletinil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-amina
- g) Ácido [1-(3-trimetilsilaniletinil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4ilamino)-acético
- h) 3,4-dietoxi-bencil-[1-(3-trimetilsilaniletinil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-amina
- i) [1-(3-trimetilsilaniletinil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-(3,4,5-trimetoxi-bencil)-amina
- j) [4-(2-metoxi-etoxi)-bencil]-[1-(3-trimetilsilaniletinil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-amina
- k) (4-metoxi-bencil-[1-(3-trimetilsilaniletinil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-amina

- l) [4-(3-morfolin-4-il-propoxi)-bencil]-[1-(3-trimetilsilaniletinil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-amina

C) Derivados de 3-yodofenil-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina

- a) N-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metil)-[1-(3-yodo-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-amina
- b) [2-(2-metoxi-etoxi)-etil]-[1-(3-yodo-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-amina
- c) [4-metoxi-3-(3-morfolin-4-il-propoxi)-bencil]-[1-(3-yodo-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-amina
- d) (3,4-dimetoxi-bencil)-[1-(3-yodo-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-amina
- e) [3,4-bis-(2-metoxi-etoxi)-bencil[1-(3-yodo-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-amina
- f) Benzo[1,3]dioxol-5-il-metil-[1-(3-yodo-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-amina
- g) Ácido [1-(3-yodo-fenil)-1H-pirazol[3,4-d]pirimidina-4ilamino)-acético
- h) 3,4-dietoxi-bencil-[1-(3-yodo-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-amina
- i) [1-(3-yodo-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4-il)-(3,4,5-trimetoxi-bencil)-amina
- j) [4-(2-metoxi-etoxi)-bencil]-[1-(3-yodo-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-amina
- k) (4-metoxi-bencil-[1-(3-yodo-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-amina
- l) [4-(3-morfolin-4-il-propoxi)-bencil]-[1-(3-yodo-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4-il)-amina

3. Derivados de pirazolo[3,4-d]pirimidina de la fórmula I de conformidad con la reivindicación 1, caracterizados porque se seleccionan de derivados de 3-cianofenil-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina

- a) 3-{4-[(2,3-dihidro-benzo[1,4]dioxin-6-ilmetil)-amino]-pirazolo[3,4-d]pirimidina-1-il}-benzonitrilo
- b) 3-{4-[2-(2-metoxi-etoxi)-etilamino]-pirazolo[3,4-d]-1-il}-benzonitrilo
- c) 3-{4-[4-metoxi-3-(3-morfolin-4-il-propoxi)-bencilamino]-pirazolo[3,4-d]pirimidin-1-il}-benzonitrilo

d) 3-[4-(3,4-dimetoxi-bencilamino)-pirazolo[3,4-d]pirimidin-1-il]-benzonitrilo

e) 3-{4-[3,4-bis-(2-metoxi-etoxi)-bencilamino]pirazolo[3,4-d]pirimidin-1-il}-benzonitrilo

f) 3-{4-[benzo[1,3]dioxol-5-ilmetil)-amino-pirazolo[3,4-d]pirimidin-1-il}-benzonitrilo

g) Ácido [1-(3-yodo-fenil)-1H-pirazol[3,4-d]pirimidina-4-ilamino)-acético

h) 3-[4-(3,4-dietoxi-bencilamino)pirazolo[3,4-d]pirimidin -1-il]-benzonitrilo

i) 3-[4-(3,4,5-trimetoxi-bencilamino)-pirazolo[3,4-d]pirimidin-1-il]benzonitrilo

j) 3-{4-[4-(2-metoxi-etoxi)-bencilamino]-pirazolo[3,4-d]pirimidin -1-il}-benzonitrilo

k) 3-[4-[4-metoxi-bencilamino)-pirazolo[3,4-d]-1-il]-benzonitrilo

l) 3-{4-[4-(3-morfolin-4-il-propoxi)-bencilamino]-pirazolo[3,4-d]pirimidin -1-il}-benzonitrilo

4. Derivados de pirazolo[3,4-d]pirimidina de la fórmula I de conformidad con la reivindicación 1, caracterizados porque se seleccionan de los derivados de 3,5-dimetil-pirazolo[3,4-d]pirimidina

a) N-((2,3-dihidrobenczo[b][1,4]dioxin-6-il)metil)-1-(3,5-dimetilfenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4-amina

b) N-(benzo[d][1,3]dioxo-5-ilmetil)-1-(3,5-dimetilfenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4-amina

c) 1-(3,5-dimetilfenil)-N-(2-(2-metoxietoxi)etil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4-amina

d) [1(3,5-dimetil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4-il]-[4-metoxi-3-(3-morfolin-4-il-propoxi)-bencil]-amina

e) (3,4-dimetoxi-bencil)-[1(3,5-dimetil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4-il]-amina

f) [3,4-bis(2-metoxi-etoxi)-bencil]-[1-(3,5-dimetil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4-il]-amina

g) Ácido [1(3,5-dimetil-fenil)-1H-pirazol[3,4-d]pirimidina-4-ilamino) acético

h) 3,4-dietoxi-bencil)-[1-(3,5-dimetil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4-il]-amina

i) [1(3,5-dimetil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4-il)-(3,4,5-trimetoxi-bencil)-amina

j) [1(3,5-dimetil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4-il]-[4-(2-metoxi-etoxi)bencilamina

k) [1(3,5-dimetil-fenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4-il]-[4-(metoxi)bencilamina

l) [1(3,5-dimetil-fenil-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4-il)-[4-(3-morfolina-4-il-propoxi)bencilamina

5. Derivados de pirazolo[3,4-d]pirimidina de la fórmula I, de conformidad con la reivindicación 1 caracterizados porque también se seleccionan de los derivados de m-tolil-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina

a) N-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metil)-1-m-tolil-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4-amina

b) [2-(2-metoxi-etoxi)-etil]-(1-m-tolil-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-amina

c) [4-metoxi-3-(3-morfolina-4-il-propoxi)-bencil]-(1-m-tolil-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-amina

d) (3,4-dimetoxi-bencil)-(1-m-tolil-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-amina

e) [3,4-bis-(2-metoxi-etoxi)-bencil]-(1-m-tolil-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-amina

f) Ácido (1-m-tolil-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4ilamino)-acético

g) 3,4-dietoxi-bencil)-(1-m-tolil-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-amina

h) (1-m-tolil-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-(3,4,5-trimetoxi-bencil)-amina

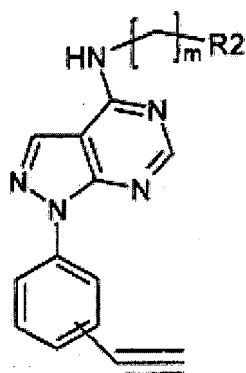
i) [4-(2-metoxi-etoxi)-bencil]-(1-m-tolil-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-amina

j) (4-metoxi-bencil)-(1-m-tolil-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-amina

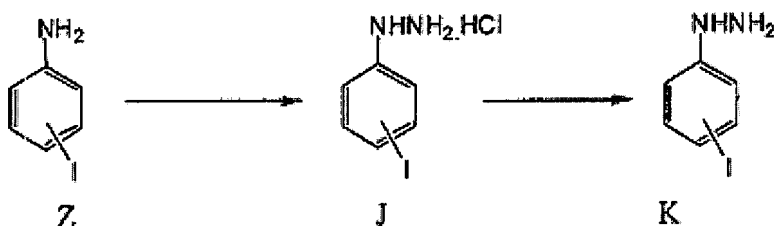
k) [4-(3-morfolin-4-il-propoxi)-bencil]-(1-m-tolil-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4il)-amina

6. Un proceso para la preparación de un compuesto de Fórmula-I de acuerdo con la reivindicación 1 seleccionado de

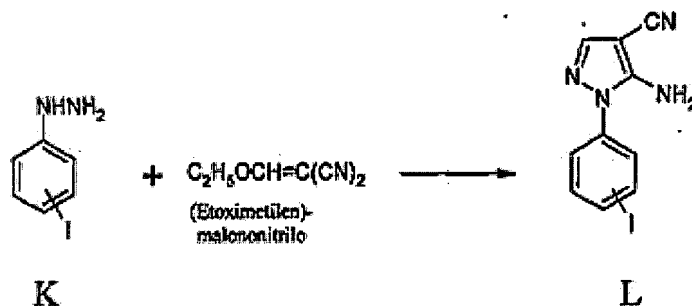
(1) un proceso para la preparación de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 en donde dicho compuesto tiene un sustituyente etinilo en el anillo N-fenilo o una sal farmacéuticamente aceptable, por cualquier proceso conocido aplicable a los compuestos relacionados químicamente



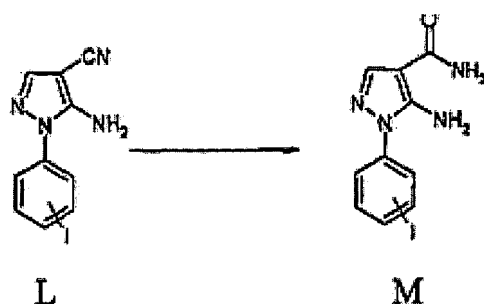
Fórmula I (con grupo acetileno)



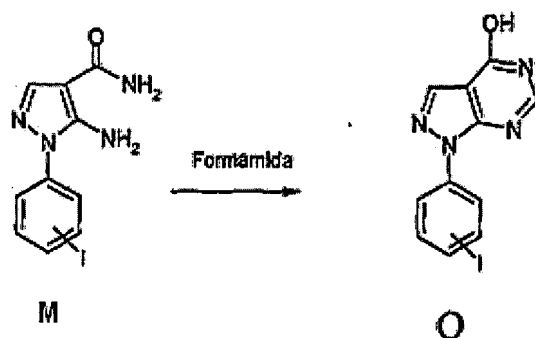
Donde el proceso comprende la diazotización de un compuesto de la fórmula Z con ácido mineral tal como ácido clorhídrico o sulfúrico y con solución de nitrito de sodio a temperaturas de -10°C a 5°C para obtener clorhidrato de fenil-hidrazina yodo-sustituido de la fórmula J neutralizando el compuesto de la fórmula J con una base adecuada tal como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de amonio y bicarbonatos de metales alcalinos para obtener la fenil-hidrazina yodo-sustituida de la fórmula K; y luego ya sea



(a) Reaccionar el compuesto de la fórmula K con etoxi-metilenemalononitrilo en solventes próticos tal como metanol, etanol, isopropanol, n-butanol, dimetil-formamida o mezclas de estos solventes a temperaturas de 60°C para obtener los nuevos fenil-5-amino-1H-pirazolo-4-carbonitrilos N-(yodo-sustituido) de la fórmula L, o (b) reaccionar los compuestos de la fórmula K con etoxi-metilenomalononitrilo generado *in situ* al hacer reaccionar ortoformiato de trietilo y malononitrilo para obtener los nuevos fenil-5-amino-1H-pirazolo-4-carbonitrilos N-(yodo-sustituidos) de la fórmula L bajo condiciones de temperatura que varían desde 40°C a 100°C .

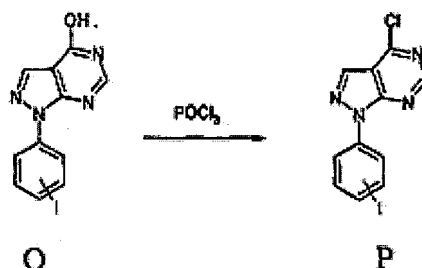


Hidrolizar el grupo nitrilo de los compuestos de la fórmula L con un ácido mineral tal como ácido sulfúrico en medio acuoso y basificar con una base adecuada tal como amoníaco o bicarbonatos, carbonatos o hidróxidos de metales alcalinos a temperaturas de 10°C a 40°C para obtener las nuevas fenil-5-amino-1H-pirazolo-4-carboxamidas N-(yodo-sustituidas) de la fórmula M;

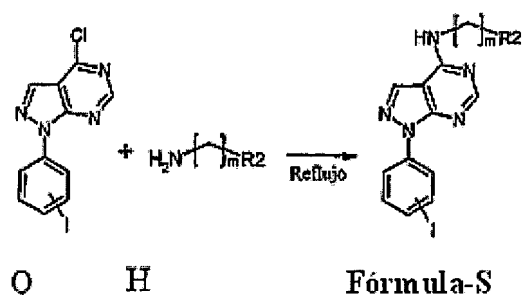


Reaccionar el compuesto de la fórmula M con formamida a condiciones puras o en solvente tal como sulfolano a temperaturas entre 150°C y 200°C para obtener la

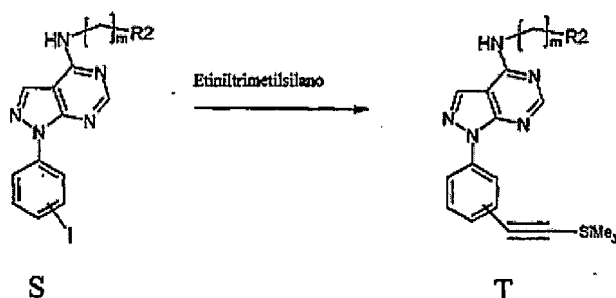
nueva fenil-5-amino-1H-pirazolo-4-carboxamida N-(yodo-sustituida) de la fórmula O, y luego ya sea



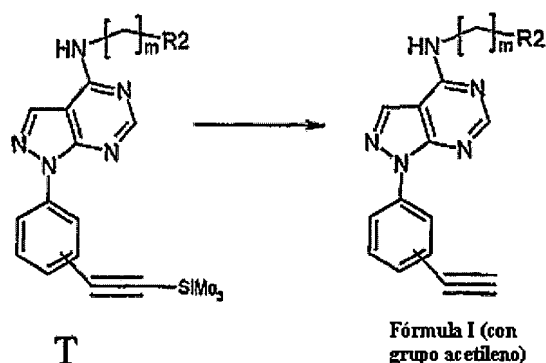
(c) Reaccionar los compuestos de la fórmula O con oxicloruro de fósforo en condiciones puras o en solventes apróticos tal como cloruro de metileno, cloruro de etileno, cloroformo o mezclas de estos solventes a condiciones de temperatura de reflujo para obtener las nuevas 4-cloro-pirazolo[3,4-d]pirimidinas N-(yodo-sustituidas) de la fórmula P, o (d) reaccionar los compuestos de la fórmula O con cloruro de tionilo, tricloruro de fósforo o pentacloruro de fósforo en solventes apróticos tal como cloruro de metileno, cloruro de etileno, cloroformo o mezcla de estos solventes a temperaturas de 25°C para obtener las nuevas 4-cloro-pirazolo[3,4-d]pirimidina N-sustituidas de la fórmula P;



Someter a reflujo del compuesto de la fórmula Q con alquil-amina sustituida de la fórmula H en solventes próticos tal como metanol, etanol, alcohol isopropílico o mezclas de estos solventes, a condiciones de temperatura de reflujo para obtener las nuevas pirazolo[3,4-d]pirimidinas sustituidas de 4-amino sustituido 1-(yodo-sustituido) de la fórmula S,

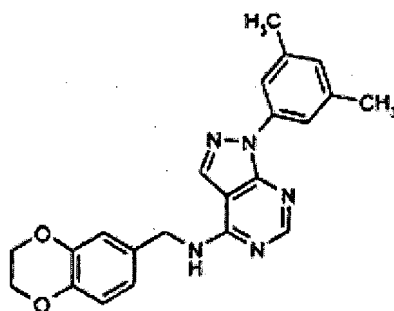


Someter a reflujo del compuesto de la fórmula S con trimetilsilil-acetileno sustituido en solventes próticos tal como metanol, etanol, alcohol isopropílico o mezclas de estos solventes a condiciones de temperatura de reflujo para obtener las nuevas N-(trimetil-silil-protégido-etinil-sustituido) fenil-4-amino sustituido-pirazolo[3,4-d]pirimidina de la fórmula T; y



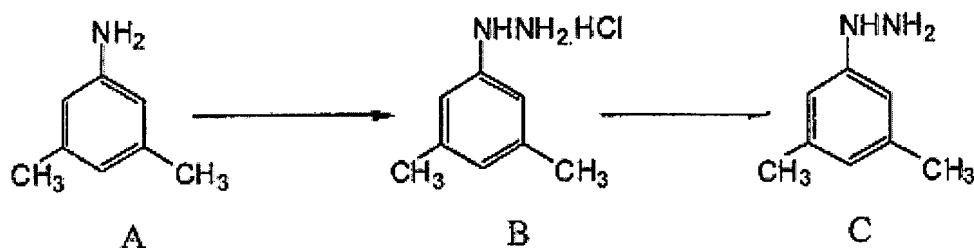
Desproteger los compuestos de la fórmula T con una base adecuada tal como amoníaco, mono-, di- o tri-alquilaminas, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de amonio y bicarbonatos de metales alcalinos para obtener los nuevos compuestos sustituidos con acetileno de la Fórmula I.

(2) un proceso para la preparación de N-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metil)-1-(3,5-dimetilfenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4-amina



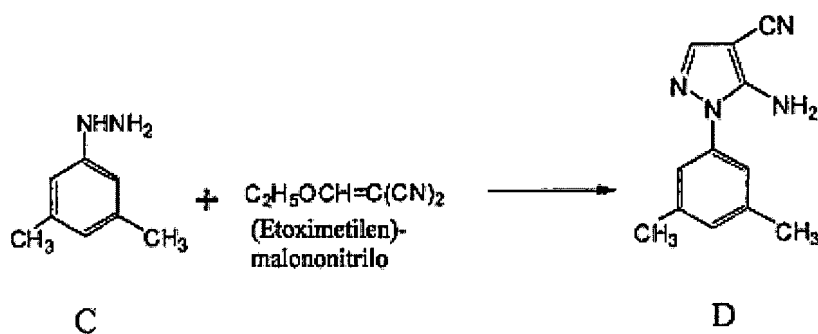
Compuesto NO: 49

o una sal del mismo, que comprende

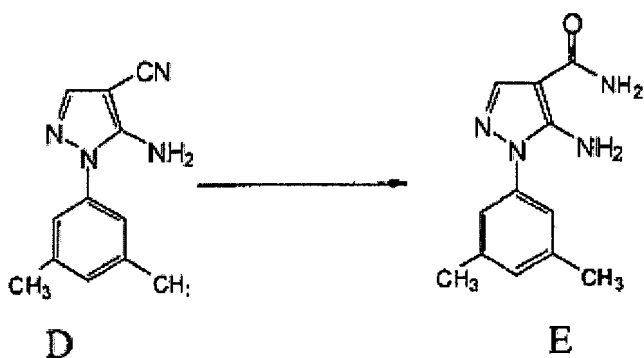


diazotizar un compuesto de la fórmula A con ácido mineral tal como ácido clorhídrico o ácido sulfúrico y con solución de nitrito de sodio a temperaturas de -10°C a 5°C para obtener clorhidrato de fenil-hidrazina sustituida de la fórmula B;

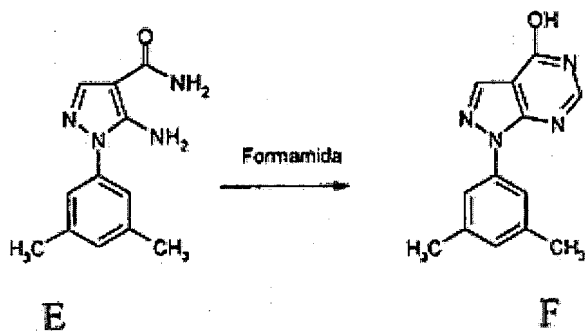
neutralizar el compuesto de la fórmula B con una base adecuada tal como amoníaco, mono-, di- o tri-alquilaminas, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de amonio y bicarbonatos de metales alcalinos para obtener las nuevas fenil-hidrazinas sustituidas de la fórmula C; y luego ya sea



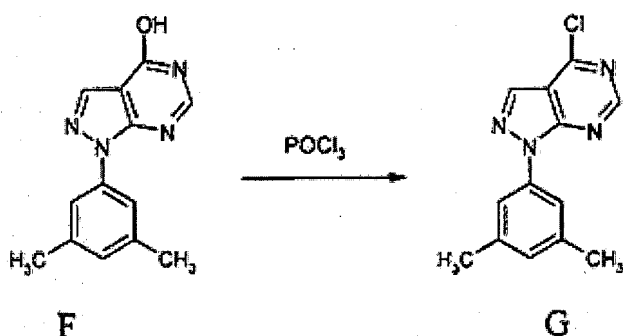
(e) reaccionar el compuesto de la fórmula C con etoximetilenomalononitrilo en solventes próticos tal como metanol, etanol, isopropanol, n-butanol, dimetilformamida o mezclas de estos solventes a temperaturas de 60°C para obtener los nuevos fenil-5-amino-1H-pirazolo-4-carbonitrilos N-sustituidos de la fórmula D o (f) reaccionar los compuestos de la fórmula C con un etoximetilenomalononitrilo generado *in situ* al hacer reaccionar ortoformiato de trietilo y malononitrilo a condiciones de temperatura en el intervalo de 40°C a 100°C para obtener los nuevos fenil-5-amino-1H-pirazolo-4-carbonitrilos N-sustituidos de la fórmula D; a condiciones de temperatura que varían de 40°C hasta 100°C.



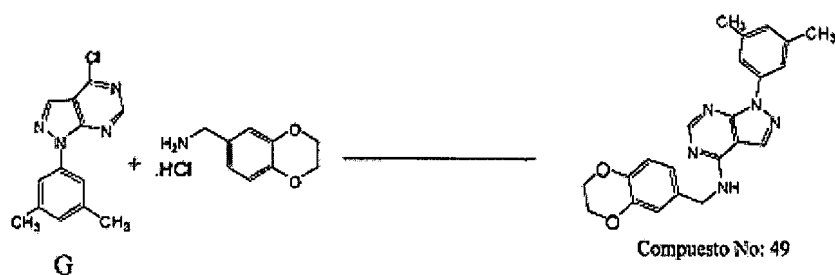
Hidrolizar el grupo nitrilo del compuesto de la fórmula D con un ácido mineral tal como ácido sulfúrico en medio acuoso y basificar con una base adecuada tal como amoníaco o bicarbonatos, carbonatos o hidróxidos de metales alcalinos a temperaturas de 10°C a 40°C para obtener las nuevas fenil-5-amino-1H-pirazolo-4-carboxamidas N-sustituidas de la fórmula E;



Hacer reaccionar el compuesto de la fórmula E con formamida en condiciones puras o en solvente tal como sulfolano a una temperatura entre 150°C y 220°C para obtener la nueva fenil-5-amino-1H-pirazolo-4-carboxamida N-sustituida de la fórmula F, y luego, bien sea



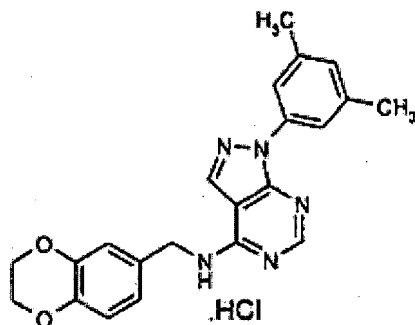
(g) Hacer reaccionar el compuesto de la fórmula F con oxiclorigeno de fósforo en un solvente aprótico tal como clorigeno de metileno, clorigeno de etileno, clorigeno o una mezcla de estos solventes a condiciones de temperatura de reflujo para obtener las nuevas 4-cloro-pirazolo[3,4-d]pirimidinas N-sustituidas de la fórmula G o (h) hacer reaccionar los compuestos de la fórmula F con clorigeno de tionilo, tricloruro de fósforo o pentaclorigeno de fósforo en solventes apróticos tal como clorigeno de metileno, clorigeno de etileno, clorigeno o mezcla de estos solventes a 25°C a temperatura de reflujo de solvente para obtener las nuevas 4-cloro-pirazolo[3,4-d]pirimidina N-sustituidas de la fórmula G; y



Someter a reflujo el compuesto de la fórmula G con clorigenato de 2,3-dihidrobenzo[1,4]dioxin-6-il-metilamina en un solvente prótico tal como metanol, etanol, alcohol isopropílico o mezclas de estos solventes, a temperatura de reflujo para

obtener la nueva N-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metil)-1-(3,5-dimetilfenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4-amina (Compuesto número 49).

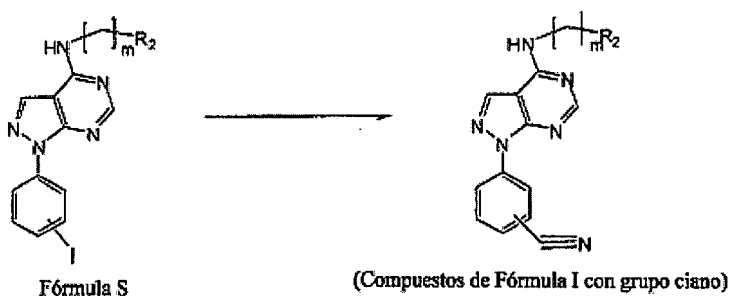
(3) un proceso para la preparación de N-(2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metil)-1-(3,5-dimetilfenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina-4-amina (Compuesto número 49. HCl)



Compuesto número 49-clorhidrato

que comprende tratar el Compuesto No. 49 con ácido clorhídrico por métodos convencionales en un medio solvente adecuado tal como agua, metanol, etanol, alcohol isopropilo, acetato de etilo, acetonitrilo, cloruro de metileno, acetona o mezcla de estos solventes, y

(4) un proceso para la preparación de un compuesto de Fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde dicho compuesto comprende un sustituyente ciano en el anillo N-fenilo o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, con cualquier proceso conocido aplicable a los compuestos químicos relacionados químicamente,



Esquema III

En donde el proceso comprende calentar el compuesto de la fórmula S con cianuro de cobre y yoduro de cobre en dimetil-formamida o dimetil-sulfóxido a temperaturas que varían desde 120°C a 145°C para obtener las nuevas N-(ciano-sustituido)-fenil-4-amino-sustituida-pirazolo[3,4-d]pirimidinas.

7. Composición farmacéutica para el tratamiento de trastorno hiperproliferativo en un mamífero, caracterizada porque comprende una cantidad terapéuticamente efectiva del compuesto de conformidad con la reivindicación 1 y un portador farmacéuticamente aceptable.

CNV\CNV\ID-223955\WPC17766

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



RECIBO DE CAJA

No. 12 - 0087147

Bogotá D.C., Agosto 23 de 2012 - 17:06:19

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	446243442	23/08/2012	7.971.200.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1	50005-01-03 CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICACIONES	DE MARCAS Y LEMAS COMERCIALES	120.000.00	120.000.00
				\$120.000.00
=====				

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

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-098749- -00005-0000

Fecha: 2012-08-27 16:35:13 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 18

0020: 17766- 841- 001-8

Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C.- Colombia

Web: www.sic.gov.co e-mail: Info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Línea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

Agosto 23 de 2012 - 17:06:48