

JOSE LLOREDA CAMACHO & CO.

ABOGADOS

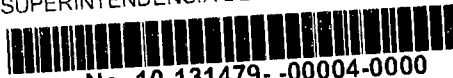
Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 6069700 Fax 6069701

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COM
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-131479- -00004-0000

Fecha: 2011-01-17 16:12:26 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 12

Re: PI.-GILEAD SCIENCES, INC.-Solicitud de Patente de Invención en Fase Nacional PCT para "NUCLEÓSIDOS DE IMIDAZOL[1,5-F][1,2,4]TRIAZINIL, IMIDAZOL[1,2-F][1,2,4]TRIAZINIL Y [1,2,4]TRIAZOLO[4,3-F][1,2,4]TRIAZINIL PARA TRATAMIENTO ANTIVIRAL".-Clase C07D 487/04.-Expediente número 10-131.479.-

1. Me refiero al Oficio No. **15776** dictado por ese Despacho notificado por fijación en lista el 3 de Diciembre de 2010.

2. Atentamente me permito allegar los recibos de pago de la tasa establecida para las reivindicaciones adicionales de la solicitud arriba mencionada.

Me permito aclarar que dicho pago corresponde a las reivindicaciones 11 a 28. Las cuales deben ser estudiadas junto con la presente solicitud.

3. Anexo me permito presentar:

(a) Recibo número 11-001904 que acredita el pago de la tasa mencionada; y

(b) Copia del capítulo reivindicatorio que debe tenerse en cuenta para estudio compuesto por **28** reivindicaciones.

4. Ruego a usted tomar atenta nota de lo anterior y proceder de conformidad.

Señor Superintendente,


ALICIA LLOREDA RICAURTE

T.P. 53.215

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800.176.089-2

- / -



RECIBO DE CAJA

No. 11 - 001904

Bogotá D.C., 12 de 2011 - 07:38:42

RECIBIDO DE : LLOREDA & CIA. S.A.

NI 830.022.145

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	142967230	11/01/2011	31.003.700.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1 50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL	99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	486.000.00	486.000.00
				\$486.000.00

SON: **CUATROCIENTOS OCHENTA Y SEIS MIL PESOS MONEDA CORRIENTE**

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-131479- -00004-0000

Fecha: 2011-01-17 16:12:26 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 12

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

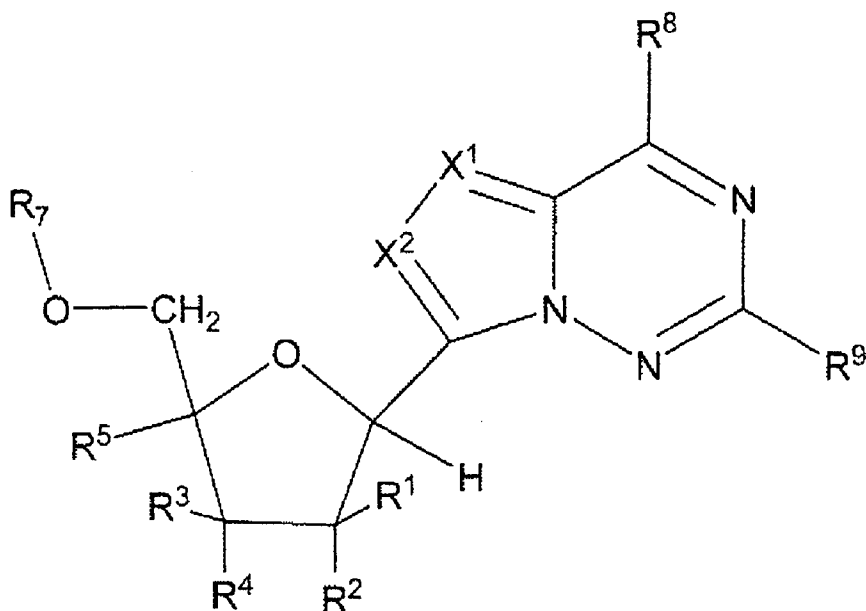
Enero 12 de 2011 - 07:39:02

214

REIVINDICACIONES

Lo que se reivindica es

1. Un compuesto de Fórmula I:



Formula I

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo;

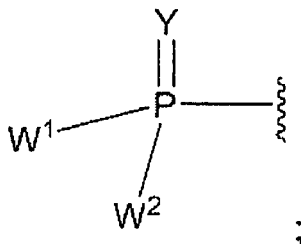
en donde:

- al menos uno de R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , o R^5 es $N(R^a)_2$, N_3 , CN , NO_2 , $S(O)_nR^a$, halógeno, alquilo(C_1-C_8), carbociclilalquilo(C_4-C_8), alquilo(C_1-C_8) sustituido, alquenilo(C_2-C_8), alquenilo(C_2-C_8) sustituido, alquinilo(C_2-C_8), alquinilo (C_2-C_8)sustituido o aril-alquilo(C_1-C_8) y cada R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , o R^5 restante es, independientemente, H , OR^a , $N(R^a)_2$, N_3 , CN , NO_2 , $S(O)_nR^a$, halógeno, alquilo(C_1-C_8), carbocicloalquilo(C_4-C_8), alquilo(C_1-C_8) sustituido, alquenilo(C_2-C_8), alquenilo(C_2-C_8)sustituido, alquinilo(C_2-C_8), alquinilo(C_2-C_8) sustituido o aril-alquilo(C_1-C_8) o cualquier dos R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , o R^5 sobre átomos de carbono adyacentes al ser tomados juntos son $-O(CO)O-$ o al ser tomados juntos con los átomos de carbono del anillo a los cuales están unidos forman un doble enlace;

cada n es independientemente 0, 1, ó 2;

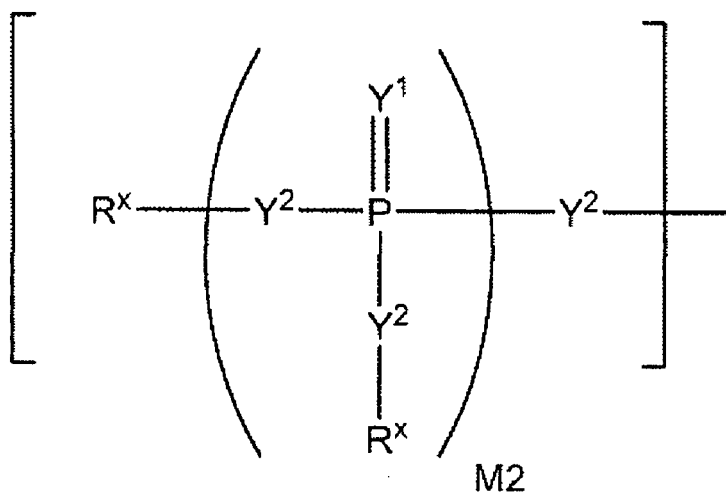
cada R^a es independientemente H, alquilo(C₁-C₈), alqueno(C₂-C₈), alquino(C₂-C₈), aril-alquilo(C₁-C₈), carbociclicalquilo(C₄-C₈), -C(=O)R¹¹, -C(=O)OR¹¹, -C(=O)NR¹¹R¹², -C(=O)SR¹¹, -S(O)R¹¹, -S(O)₂R¹¹, -S(O)(OR¹¹), -S(O)₂(OR¹¹), -SO₂NR¹¹R¹²;

- 5 R^7 es H, -C(=O)R¹¹, -C(=O)OR¹¹, -C(=O)NR¹¹R¹², -C(=O)SR¹¹, -S(O)R¹¹, -S(O)₂R¹¹, -S(O)(OR¹¹), -S(O)₂(OR¹¹), -SO₂NR¹¹R¹², o



cada Y o Y¹ es, independientemente, O, S, NR, ⁺N(O)(R), N(OR), ⁺N(O)(OR), o N-NR₂;

- 10 W^1 y W^2 , al ser tomados juntos, son -Y³(C(R^y)₂)₃Y³-; o uno de W^1 o W^2 junto con ya sea R³ o R⁴ es -Y³- y el otro de W^1 o W^2 es la Fórmula Ia; o W^1 y W^2 son cada uno, independientemente, un grupo de la Fórmula Ia:



Formula Ia

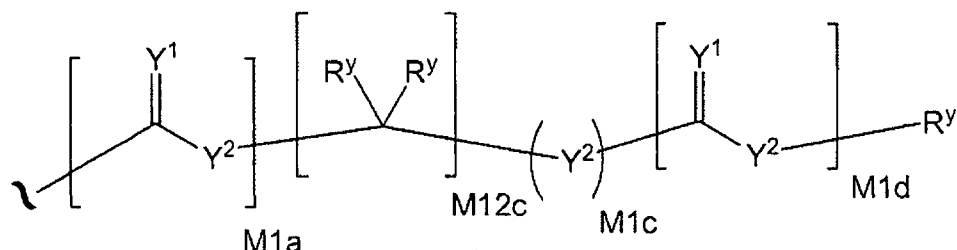
en donde:

- 15 cada Y² es independientemente un enlace, O, CR₂, NR, ⁺N(O)(R), N(OR), ⁺N(O)(OR), N-NR₂, S, S-S, S(O), o S(O)₂;

cada Y³ es independientemente O, S, o NR;

M2 es 0, 1 ó 2;

Cada R^x es independientemente R^y o la fórmula:



en donde:

5 cada M1a, M1c, y M1d es independientemente 0 ó 1 ;

M12c es 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 ó 12;

10 cada R^y es independientemente H, F, Cl, Br, I, OH, R, -C(=Y¹)R, -C(=Y¹)OR, -C(=Y¹)N(R)₂, -N(R)₂, -⁺N(R)₃, -SR, -S(O)R, -S(O)₂R, -S(O)(OR), -S(O)₂(OR), -OC(=Y¹)R, -OC(=Y¹)OR, -OC(=Y¹)(N(R)₂), -SC(=Y¹)R, -SC(=Y¹)OR, -SC(=Y¹)(N(R)₂), -N(R)C(=Y¹)R, -N(R)C(=Y¹)OR, -N(R)C(=Y¹)N(R)₂, -SO₂NR₂, -CN, -N₃, -NO₂, -OR, o W³ ; o al ser tomados juntos, dos R^y en el mismo átomo de carbono forman un anillo carbocíclico de 3 a 7 átomos de carbono;

15 cada R es independientemente H, alquilo(C₁-C₈), alquilo(C₁-C₈) sustituido, alquenilo(C₂-C₈), alquenilo(C₂-C₈) sustituido, alquinilo(C₂-C₈), alquinilo(C₂-C₈) sustituido, arilo C₆-C₂₀, arilo C₆-C₂₀ sustituido, heterociclilo C₂-C₂₀, heterociclilo C₂-C₂₀ sustituido, arilalquilo o arilalquilo sustituido;

W³ es W⁴ o W⁵; W⁴ es R, -C(Y¹)R^y, -C(Y¹)W⁵, -SO₂R^y, o -SO₂W⁵; y W⁵ es un carbociclo o un heterociclo en donde W⁵ está independientemente sustituido con 0 a 3 grupos R^y;

20 cada X¹ o X² es independientemente C-R¹⁰ o N en donde por lo menos uno de X¹ o X² es N;

25 cada R⁸ es, independientemente, halógeno, NR¹¹R¹², N(R¹¹)OR¹¹, NR¹¹NR¹¹R¹², N₃, NO, NO₂, CHO, CN, -CH(=NR¹¹), -CH=NHNR¹¹, -CH=N(OR¹¹), -CH(OR¹¹)₂, -C(=O)NR¹¹R¹², -C(=S)NR¹¹R¹², -C(=O)OR¹¹, alquilo(C₁-C₈), alquenilo(C₂-C₈), alquinilo(C₂-C₈), carbociclilalquilo(C₄-C₈), arilo opcionalmente

sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, alquilo-C(=O)(C₁-C₈), -S(O)_n-alquilo(C₁-C₈) o aril-alquilo(C₁-C₈), OR¹¹ o SR¹¹;

5 cada R⁹ o R¹⁰ es independientemente H, halógeno, NR¹¹R¹², N(R¹¹)OR¹¹, NR¹¹NR¹¹R¹², N₃, NO, NO₂, CHO, CN, -CH(=NR¹¹), -CH=NHNR¹¹, -CH=N(OR¹¹), -CH(OR¹¹)₂, -C(=O)NR¹¹R¹², -C(=S)NR¹¹R¹², -C(=O)OR¹¹, R¹¹, OR¹¹ o SR¹¹;

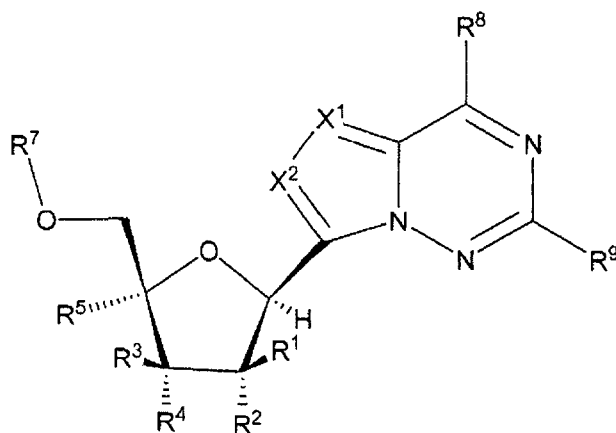
10 cada R¹¹ o R¹² es independientemente H, alquilo (C₁-C₈), alqueno(C₂-C₈), alquino(C₂-C₈), carbociclilalquilo(C₄-C₈), arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, -C(=O)-alquilo(C₁-C₈), -S(O)_n-alquilo(C₁-C₈) o aril-alquilo(C₁-C₈); o R¹¹ y R¹² tomados junto con un átomo de nitrógeno al que ambos están unidos forman un anillo heterocíclico de 3 a 7 miembros en donde cualquier átomo de carbono de dicho anillo heterocíclico puede ser reemplazado opcionalmente con -O-, -S- o -NR^a;

15 en donde cada alquilo(C₁-C₈), alqueno(C₂-C₈), alquino(C₂-C₈) o aril-alquilo(C₁-C₈) de cada R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R¹¹ o R¹² está, independientemente, opcionalmente sustituido con uno o más halo, hidroxilo, CN, N₃, N(R^a)₂ o OR^a; y en donde uno o más de los átomos de carbono no terminales de cada uno de dichos alquilo(C₁-C₈) puede ser opcionalmente reemplazado con -O-, -S- o -NR^a.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 en donde R⁸ es halógeno, NR¹¹R¹², N(R¹¹)OR¹¹, NR¹¹NR¹¹R¹², OR¹¹ o SR¹¹.

20 3. Un compuesto de acuerdo con las reivindicaciones 1 ó 2 en donde R⁹ es H o NR¹¹R¹².

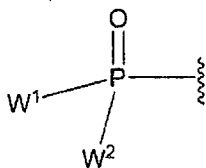
4. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-3 representado por la Fórmula II



Formula II

en donde cada Y y Y¹ es O.

5. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-4 en donde R⁷ es H o



5 6. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-5 en donde X¹ es N y R³ es H.

7. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-6 en donde al menos uno de R² o R⁴ es OR^a

10 8. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-7 en donde cada R² y R⁴ es OR^a.

9. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-8 en donde X² es CH y R¹ se selecciona de metilo, CH₂OH, CH₂F, etenilo, o etinilo.

10. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-8 en donde X² es CH, R¹ es H y R⁵ es N₃, CN, metilo, CH₂OH, etenilo, o etinilo.

15 11. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-9 en donde R¹ es metilo.

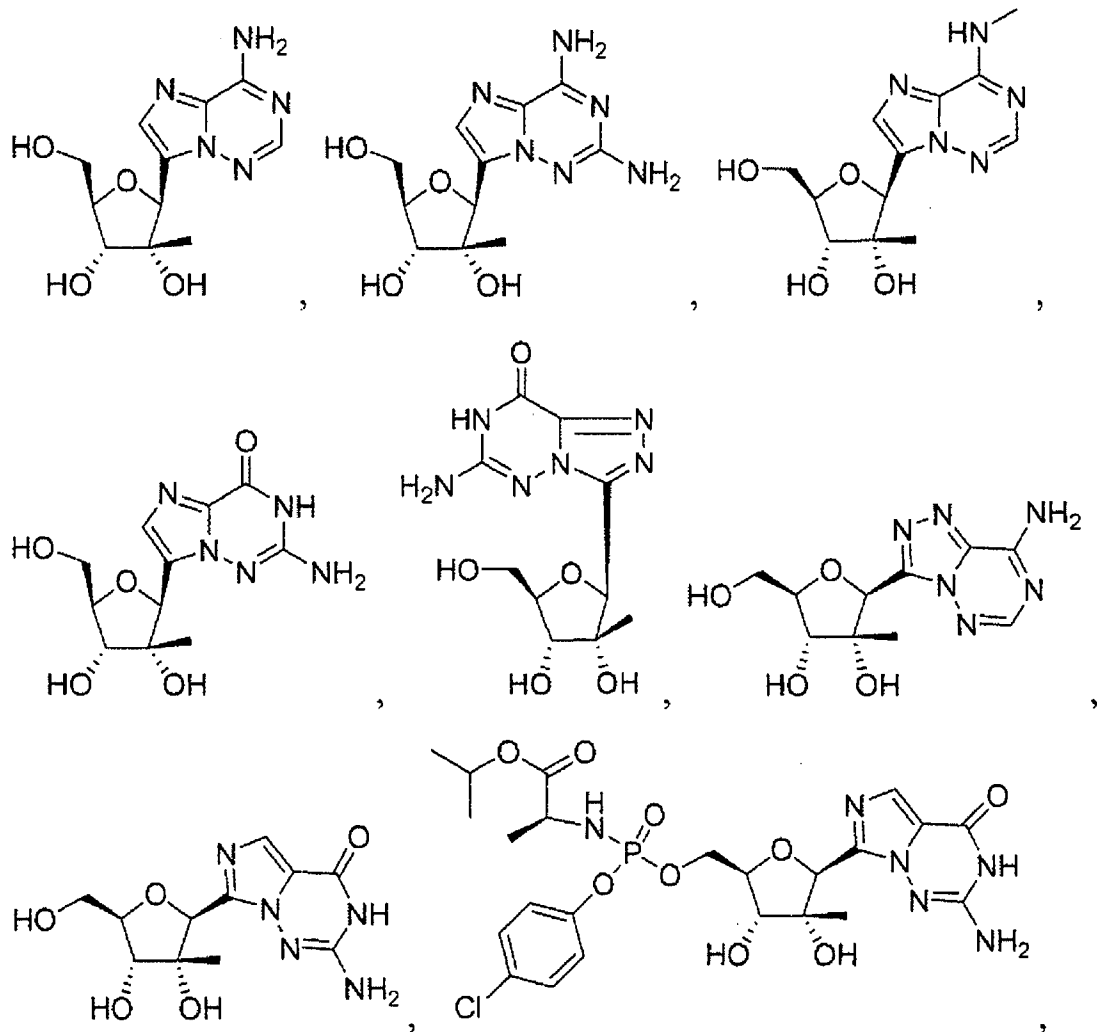
12. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-9 ó 11 en donde R⁵ es H.

20 13. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-12 en donde R² y R⁴ son OH.

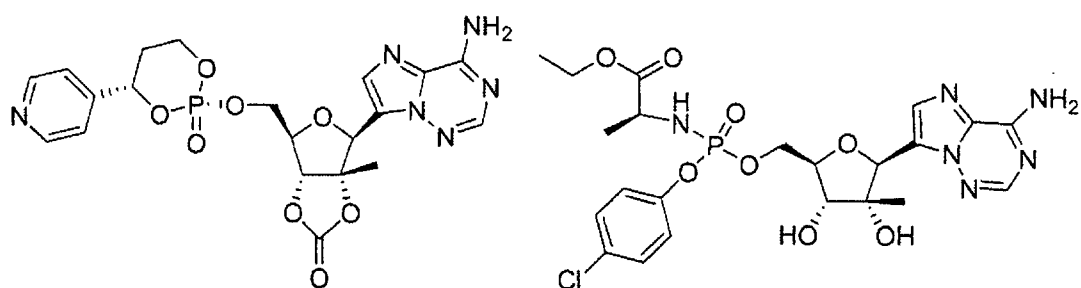
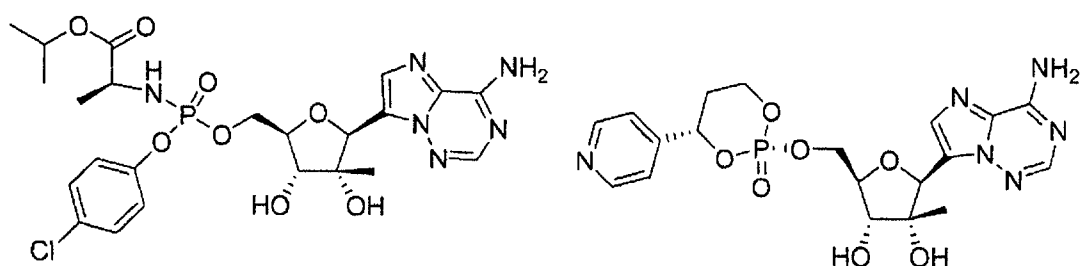
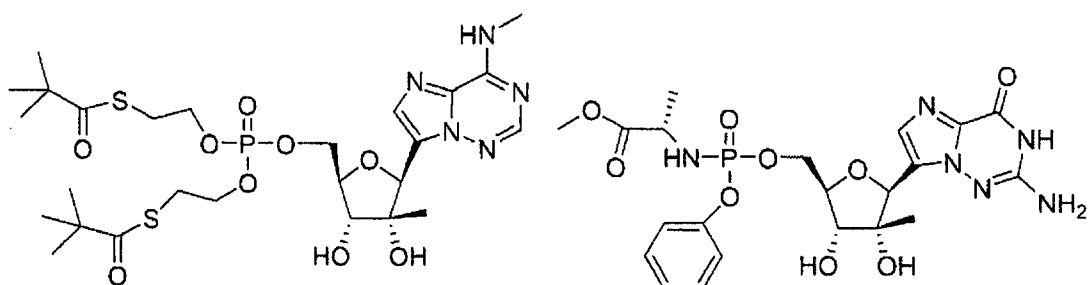
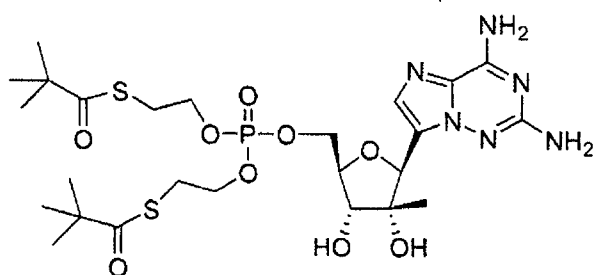
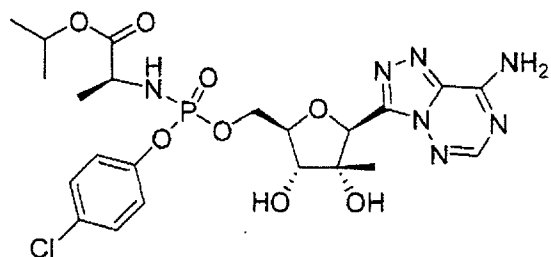
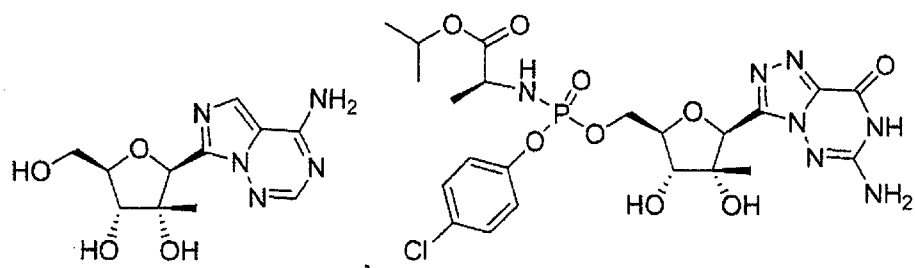
14. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-13 en donde W¹ y W² son cada uno, independientemente, un grupo de la Fórmula Ia.

15. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-13 en donde R⁷ es H.

25 16. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 que es



20



18. Una composición farmacéutica que comprende una cantidad terapéuticamente efectiva de un compuesto como en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 17 y un portador farmacéuticamente aceptable.
19. La composición farmacéutica de la reivindicación 18 que comprende al menos
5 un agente terapéutico adicional.
20. La composición farmacéutica de la reivindicación 19, en donde dicho agente terapéutico adicional se selecciona del grupo que consiste de interferones, análogos de ribavirina, inhibidores de la proteasa NS3, inhibidores NS5a, inhibidores de la polimerasa NS5b, inhibidores de la alfa-glucosidasa 1, inhibidores de ciclofilina,
10 hepatoprotectores, inhibidores no nucleósidos del VHC. y otros fármacos para tratar el VHC.
21. Un método para inhibir la VHC polimerasa que comprende la administración a un mamífero en necesidad de tal tratamiento una cantidad terapéuticamente efectiva de un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 16.
- 15 22. Un método para tratar una infección viral causada por un virus de la familia *Flaviviridae* que comprende la administración a un mamífero en necesidad de tal tratamiento una cantidad terapéuticamente efectiva de un compuesto o composición farmacéutica de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 16.
- 20 23. El método de la reivindicación 22 en donde la infección viral es causada por un virus seleccionado del grupo que consiste del virus del dengue, virus de la fiebre amarilla, virus del Nilo Occidental, virus de la encefalitis Japonesa, virus de la encefalitis por garrapatas, virus Kunjin, virus de la encefalitis del Valle de Murray, virus de la encefalitis de St. Louis, virus de la fiebre hemorrágica de Omsk, virus de la diarrea viral bovina, virus Zika y virus de la Hepatitis C.
- 25 24. El método de la reivindicación 23 en donde la infección viral es causada por el virus de la Hepatitis C.
25. El método de cualquiera de las reivindicaciones 22-24 que comprende además la administración de al menos un agente terapéutico adicional.
- 30 26. El método de la reivindicación 25 en donde dicho al menos un agente terapéutico adicional se selecciona del grupo que consiste de interferones, análogos de ribavirina, inhibidores de la proteasa NS3, inhibidores de la polimerasa NS5b, inhibidores NS5a, inhibidores de la alfa-glucosidasa 1, inhibidores de ciclofilina,

hepatoprotectores, inhibidores no nucleósidos del VHC, y otros fármacos para tratar el VHC.

27. Un compuesto como en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 16 usado en la fabricación de un medicamento para tratar una infección viral causada por un virus
5 seleccionado del grupo que consiste del virus del dengue, virus de la fiebre amarilla, virus del Nilo Occidental, virus de la encefalitis Japonesa, virus de la encefalitis por garrapatas, virus Kunjin, virus de la encefalitis del Valle de Murray, virus de la encefalitis de St. Louis, virus de la fiebre hemorrágica de Omsk, virus de la diarrea viral bovina, virus Zika y virus de la Hepatitis C.
- 10 28. Un compuesto o método como se describe aquí.

2020
Bogotá D.C.,

Doctor(a)
LLOREDA RICAURTE ALICIA
Apoderado(a) y/o Representante de
GILEAD SCIENCES, INC.

REFERENCIA	Radicación No.	10 131479
	Solicitud internacional	PCT/US2009/041432
	Fecha inicio fase nacional	23/11/2010
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	416
	Oficio No.	12987
	Folios	1

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, el Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), el Reglamento y la Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de Comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial.

Cúmplase
Dado en Bogotá DC,

28 ABR. 2011



JOSE LUIS SALAZAR LOPEZ
Director de Nuevas Creaciones (C)

jfernand