



No. 10-118687-00006-0000

Fecha: 2012-01-13 10:28:25 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYI Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Follos: 7

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

P2010/000125

SOLICITUD DE:

1

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Solicitud.

2

SOLICITANTE
(71)

Nombre: INCYTE CORPORATION

Dirección: Experimental Station Building 336, Route 141 & Henry Clay Road, Wilmington, DE 19880

Nacionalidad Domicilio: Estadounidense

Lugar de Constitución: Estados Unidos de América

Teléfono: _____

Fax: _____

E-mail: _____

IDENTIFICACIÓN

C.C.

☐

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual _____

Número _____

3

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: CARLOS R. OLARTE

Dirección: Carrera 5 No. 34-03 Bogotá, D.C. Colombia

Teléfono: 601-7700 Fax: 601-7799

E-mail: office@olartemoure.com

IDENTIFICACIÓN

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual _____

Número 79.782.747 Bta TP 74.295

4

Número de expediente:
10-118.687

5

Descripción de la corrección o modificación solicitada Se han eliminado las Reivindicaciones 16, 17, 27-109, 111-121 y 123 a 130;
Se han fusionado las Reivindicaciones 1, 18 y 110 en la nueva Reivindicación 1.

6

Comprobante de pago No. 12-

Fecha Enero 11 de 2012

7

Anexos

☒

Comprobante de pago de la tasa de modificaciones en trámite \$120.000

☐

Comprobante de pago de la tasa de 17 reivindicaciones adicionales \$420.000

☐

Poderes, si fuere el caso. Documento que soporta la cesión de Derechos.

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

8

NOMBRE: CARLOS R. OLARTE

FIRMA: _____

C.C. 79.782.747 Bta T.P. 74.295

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

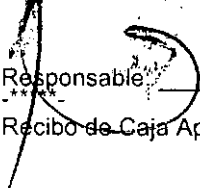
 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA	RECIBO DE CAJA	No. 12 - 002689
		Bogotá D.C., Enero 11 de 2012 - 16:34:36

RECIBIDO DE : OLARTE MOURE & ASOCIADOS	NI 830.122.870
--	----------------

*** Soporte del Pago ***					
TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	409132846	11/01/2012	25.031.000.00

*** Conceptos Pagados ***				
CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr. UNDITARIO	Vr. CONCEPTO
1	50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL	99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	420.000.00	420.000.00
				\$420.000.00
			=====	

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

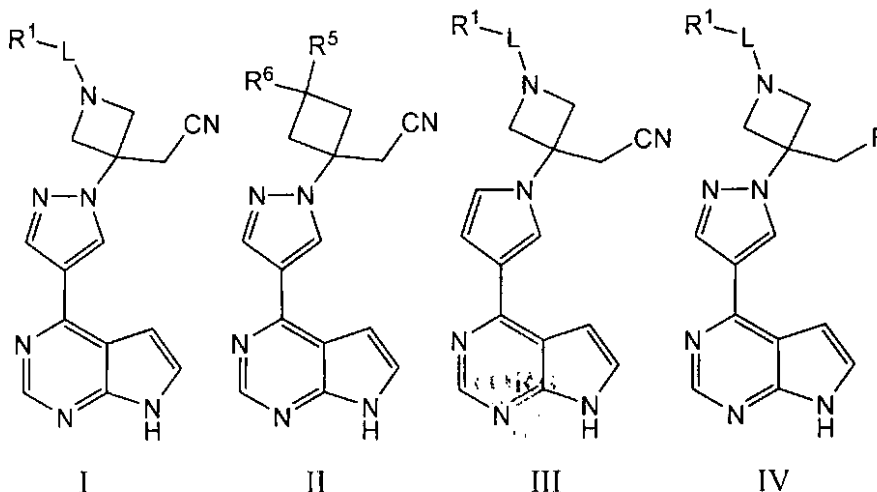
Responsable  _____
Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 10-118687 - 00006-0000
Fecha: 2012-01-13 10:28:25 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 7

CAPITULO REIVINDICATORIO MODIFICADO (Modificaciones Voluntarias)

1. Un compuesto de Fórmula I, II, III y IV:



o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, en donde

L es SO₂ o CO;

R¹ es alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₇, fenilo, heteroarilo de 5 a 6 miembros, indolilo, NR²R³, u OR⁴, en donde dicho alquilo, cicloalquilo, fenilo o heteroarilo está opcionalmente sustituido por 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre F, CN y alquilo C₁₋₄;

R² y R³ son seleccionados independientemente entre H, alquilo C₁₋₄, y fenilo;

R⁴ es alquilo C₁₋₆, fenilo, o bencilo;

R⁵ y R⁶ son independientemente seleccionados entre H, F, CN, OH, alquilo C₁₋₄, benciloxi, dialquilaminosulfonil C₂₋₈, y heteroarilo de 5 miembros, en donde dicho alquilo está opcionalmente sustituido por 1, 2 o 3 sustituyente seleccionados entre F, OH, CN y alquilo C₁₋₄, y donde dicho heteroarilo de 5 miembros está opcionalmente sustituido por alquilo C₁₋₄;

en donde cuando L es SO₂, R¹ es diferente a OR⁴, y en donde cuando uno de R⁵ y R⁶ es OH, el otro entre R⁵ y R⁶ es diferente a CN o F.

2. El compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde L es SO₂.

3. El compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde L es CO.

4. El compuesto de acuerdo con las Reivindicaciones 1-3, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R^1 es metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-metilprop-1-ilo, 1-metil-1-prop-ilo, cada uno opcionalmente sustituido por 1, 2 o 3 F.
5. El compuesto de acuerdo con las Reivindicaciones 1-3, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R^1 es alquilo C_{1-6} .
6. El compuesto de acuerdo con las Reivindicaciones 1-3, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R^1 es etilo.
7. El compuesto de acuerdo con las Reivindicaciones 1-3, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R^1 es cicloalquilo C_{3-7} , opcionalmente sustituido por alquilo C_{1-4} .
8. El compuesto de acuerdo con las Reivindicaciones 1-3, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R^1 es fenilo, opcionalmente sustituido por F, metilo o CN.
9. El compuesto de acuerdo con las Reivindicaciones 1-3, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R^1 es un heteroarilo de 5 miembros, seleccionado entre tienilo, pirazolilo, pirrolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, y isoxazolilo, cada uno opcionalmente sustituido con alquilo C_{1-4} .
10. El compuesto de acuerdo con las Reivindicaciones 1-3, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R^1 es piridinilo.
11. El compuesto de acuerdo con las Reivindicaciones 1-3, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R^1 es NR^2R^3 u OR^4 .
12. El compuesto de la Reivindicación 1, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde L es SO_2 y R^1 es alquilo C_{1-6} .
13. El compuesto de la Reivindicación 1 seleccionado entre:
 {1-(etilsulfonil)-3-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidín-3-il} acetónitrilo;
 1-(ciclopropilsulfonil)-3-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidín-3-il acetónitrilo;
 1-[(1-metilciclopropil)carbonil]-3-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidín-3-il acetónitrilo;

1-[(1-metilciclopropil)sulfonil]-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidín-3-ilacetonitrilo;

1-(metilsulfonil)-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidín-3-il}acetonitrilo;

{1-(fenilsulfonil)-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidín-3-il}acetonitrilo;

{1-(isopropilsulfonil)-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidín-3-il}acetonitrilo;

{1-(propilsulfonil)-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidín-3-il}acetonitrilo;

{1-(butilsulfonil)-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidín-3-il}acetonitrilo;

{1-(tert-butilsulfonil)-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidín-3-il}acetonitrilo;

3-(cianometil)-N,N-dimetil-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidín-1-sulfonamida;

{1-[(1-metil-1H-pirazol-3-il)sulfonil]-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidín-3-il}acetonitrilo;

{3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-[(3,3,3-trifluoropropil)sulfonil]azetidín-3-il}acetonitrilo;

{1-(isobutilsulfonil)-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidín-3-il}acetonitrilo;

{1-(sec-butilsulfonil)-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidín-3-il}acetonitrilo;

{1-[(5-metil-2-tienil)sulfonil]-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidín-3-il}acetonitrilo;

{1-[(4-fluorofenil)sulfonil]-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidín-3-il}acetonitrilo;

{1-[(3-fluorofenil)sulfonil]-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidín-3-il}acetonitrilo;

{1-[(2-fluorofenil)sulfonil]-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidín-3-il}acetonitrilo;

{1-(piridin-3-ilsulfonil)-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidín-3-il}acetonitrilo;

{1-(piridin-2-ilsulfonil)-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidín-3-il}acetonitrilo;

{1-(ciclopropilcarbonil)-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidín-3-il}acetonitrilo;

1-[(1-metilciclopropil)carbonil-3-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il]acetonitrilo;

{1-benzoil-3-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[(6-metilpiridin-2-il)carbonil]-3-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-(piridin-3-ilcarbonil)-3-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-(3-metilbenzoil)-3-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-(4-metilbenzoil)-3-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

3-({3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}carbonil)benzonitrile;

[3-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-(2-tienilcarbonil)azetidin-3-il]acetonitrilo;

[3-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-(1H-pirrol-2-ilcarbonil)azetidin-3-il]acetonitrilo;

{1-(1H-indol-2-ilcarbonil)-3-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-(isoxazol-5-ilcarbonil)-3-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-(1H-pirazol-3-ilcarbonil)-3-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-carboxilato de isobutilo;

3-(canometil)-3-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-carboxilato de fenilo;

3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-carboxilato de bencilo; y

3-(cianometil)-N-fenil-3-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-carboxamida;

o una sal farmacéuticamente aceptable de cualquiera de los antes mencionados.

14. El compuesto {1-(etilsulfonil)-3-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

15. Sal del ácido fosfórico del compuesto {1-(etilsulfonyl)-3-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pyrimidin-4-yl)-1H-pirazol-1-yl]azetidin-3-yl}acetonitrilo.

16. El compuesto de la Reivindicación 1, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde uno de R⁵ y R⁶ es H y el otro se selecciona entre H, F, CN, OH, alquilo C₁₋₄, benciloxi, dialquilaminosulfonyl C₂₋₈, y heteroarilo de 5 miembros, en donde dicho alquilo está opcionalmente sustituido por 1, 2, o 3 sustituyentes, seleccionados entre F, OH, CN y alcoxi C₁₋₄, y en donde el heteroarilo de 5 miembros está opcionalmente sustituido por alquilo C₁₋₄.

17. El compuesto de acuerdo con la Reivindicación 16, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R⁵ y R⁶ son seleccionados independientemente entre H, F, CN, OH y metilo.

18. El compuesto de la Reivindicación 16, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R⁵ y R⁶ son seleccionados independientemente entre H y CN.

19. El compuesto de la Reivindicación 1 seleccionado entre:

3-(cianometil)-N,N-dimetil-3-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pyrimidin-4-yl)-1H-pirazol-1-yl]ciclobutanesulfonamida;

3-isoxazol-3-yl-1-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pyrimidin-4-yl)-1H-pirazol-1-yl]ciclobutilacetonitrilo;

{3-(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-yl)-1-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pyrimidin-4-yl)-1H-pirazol-1-yl]ciclobutil}acetonitrilo;

{3-(3-tert-butyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl)-1-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pyrimidin-4-yl)-1H-pirazol-1-yl]ciclobutil}acetonitrilo;

1-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pyrimidin-4-yl)-1H-pirazol-1-yl]ciclobutilacetonitrilo;

3-(hidroximetil)-1-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pyrimidin-4-yl)-1H-pirazol-1-yl]ciclobutilacetonitrilo;

3-(fluorometil)-1-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pyrimidin-4-yl)-1H-pirazol-1-yl]ciclobutilacetonitrilo;

3-(difluorometil)-1-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pyrimidin-4-yl)-1H-pirazol-1-yl]ciclobutilacetonitrilo;

2,2'-[1-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pyrimidin-4-yl)-1H-pirazol-1-yl]ciclobutane-1,3-diyl]diacetonitrilo;

3-(cianometil)-1-metil-3-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pyrimidin-4-yl)-1H-pirazol-1-yl]ciclobutanocarbonitrilo;

3-(cianometil)-1-(metoximetil)-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]ciclobutanocarbonitrilo;

3-(cianometil)-1-(fluorometil)-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]ciclobutanocarbonitrilo;

1,3-bis(cianometil)-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]ciclobutanocarbonitrilo;

3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]ciclobutanocarbonitrilo;

3,3-bis(hidroximetil)-1-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]ciclobutilacetonitrilo;

3,3-bis(fluorometil)-1-[4-(7-[2-(trimetilsilil)etoxi]metil-7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]ciclobutilacetonitrilo;

2,2',2''-1-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]ciclobutano-1,3,3-triyl]triacetonitrilo;

3-hidroxi-1-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]ciclobutilacetonitrilo;

3-fluoro-1-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]ciclobutilacetonitrilo;

3-metil-1-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]ciclobutilacetonitrilo;

3,3-dimetil-1-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]ciclobutilacetonitrilo; y

3-(benciloxi)-1-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]ciclobutilacetonitrilo;

o una sal farmacéuticamente aceptable de cualquiera de los antes mencionados.

20. El compuesto 3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]ciclobutanocarbonitrilo, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

21. El compuesto cis-3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]ciclobutanocarbonitrilo, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

22. El compuesto trans-3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]ciclobutanocarbonitrilo, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

23. El compuesto de la Reivindicación 1 que se selecciona entre:

{1-(etilsulfonil)-3-[3-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirrol-1-il]azetidín-3-il}acetonitrilo; y

7

4-{1-[1-(etilsulfonil)-3-(fluorometil)azetidin-3-il]-1H-pirazol-4-il}-7H-pirrol[2,3-d]pirimidina;

o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos.

24. Una composición que comprende un compuesto de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1-23, o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, y por lo menos un vehículo farmacéuticamente aceptable.

ANEXO EXPLICATIVO DE LAS MODIFICACIONES

- Se han eliminado las Reivindicaciones 16, 17, 27-109, 111-121 y 123 a 130;
- Se han fusionado las Reivindicaciones 1, 18 y 110 en la nueva Reivindicación 1;