23

Clarke, Mod

COLOMB

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 11-000461--00002-0000
Fecha: 2011-04-14 15:03:28 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 23

P-2797

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
E. S. D.

Ref.: Expediente No. **11.000.461**
Solicitud de Patente a nombre de **JANSSEN PHARMACEUTICA N.V.**

Yo, DILIA MARIA RODRIGUEZ D'ALEMAN identificada como aparece al pie de mi firma, domiciliada en la Cra. 11 No. 86-53 Piso 6, obrando como apoderada de la sociedad **JANSSEN PHARMACEUTICA N.V.,** domiciliada en Beerse, Bélgica, solicitante de la patente de la referencia, me permito informar lo siguiente:

Con fundamento en la facultad que confiere el artículo 34 de la Decisión 486 al solicitante para modificar la solicitud de patente en cualquier momento del trámite, presento junto con este memorial nuevo pliego reivindicatorio que consta de las mismas 42 reivindicaciones, en donde se modificó la condición planteada en la reivindicación 39, de acuerdo con lo consignado en la página 17, líneas 20 a 22 de la memoria descriptiva.

Para este efecto, me permito acompañar el recibo No. 11-0026894 del 25 de marzo de 2011 con el cual, queda cubierta la tasa correspondiente a la modificación de una solicitud de patente.

Señor Superintendente,

DILIA MARÍA RODRÍGUEZ D´ALEMAN
C.C. 41.654.882 de Bogotá.
T.P. 20824 CSJ

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

SOLICITUD DE:

1

[ ] **Corrección de error material** [X] **Modificación a una solicitud.**

2 **SOLICITANTE (71)**	Nombre: JANSSENPHARMACEUTICA N.V. Dirección: Turnhoutseweg 30, b-2340 Beerse, Bélgica Nacionalidad o domicilio: Beerse, Bélgica Lugar de Constitución: Bélgica Teléfono: Fax: E-mail	**IDENTIFICACIÓN** C.C. [X] NIT [ ] C.E. [ ] Otro [ ] Cual _____ Número _____
3 **REPRESENTANTE O APODERADO (74)**	Nombre: DILIA MARÍA RODRÍGUEZ D´ALEMAN Dirección: Carrera 11 No. 86-53, piso 6 Teléfono: 6 181088 Fax: 6350824 E-mail: clarkemodet@clarkemodet.com.co	**IDENTIFICACIÓN** C.C. [X] NIT [ ] C.E. [ ] Otro [ ] Cual _____ Número 41.654.882 TP 20824 CSJ

4 Número del expediente: 11.000.461

5 Descripción de la corrección o modificación solicitada: **Que se anote:** " Que se anote: se presenta de nuevo el pliego reivindicatorio donde se modificó la condición planteada en la reivindicación 39, de acuerdo con lo consignado en la página 17, líneas 20 a 22 de la memoria descriptiva."

Comprobante de pago No. 11-0026894 de Marzo 25 de 2011

7 Anexos:

[■] Comprobante de pago de la tasa

[ ] Poderes si fuese el caso

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

8

NOBRE DILIA RODRIGUEZ D´ALEMAN **FIRMA** _____

C.C. 41.654.882 **T.P.** 20824 CSJ

p-p-2797

239

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

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0026894

Bogotá D.C., Marzo 25 de 2011 - 07:06:52

RECIBIDO DE : CLARKE MODET NI 830.008.643

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR.PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	325077546	23/03/2011	95.510.000.00

*** Conceptos Pagados ***

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

SON: **CIENTO DIECIOCHO MIL PESOS MONEDA CORRIENTE*

Responsable: _____
****

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

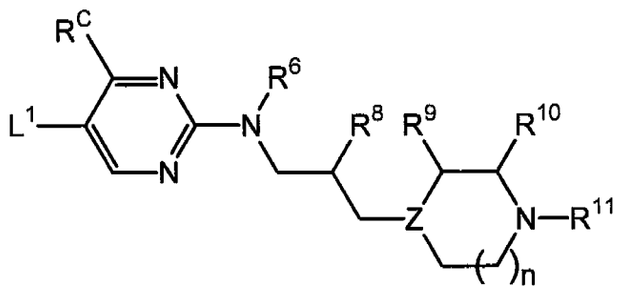
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 11-000461- -00002-0000
Fecha: 2011-04-14 15:03:28 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 23

p-2797

2

REIVINDICACIONES

1. Un proceso para la preparación de un compuesto de Fórmula (I)



(I),

en donde

L^1 es CN;

R^c se selecciona del grupo que consiste de H, metilo, etilo, propilo, isopropilo, $-CF_3$, ciclopropilo, y ciclobutilo;

R^6 es hidrógeno;

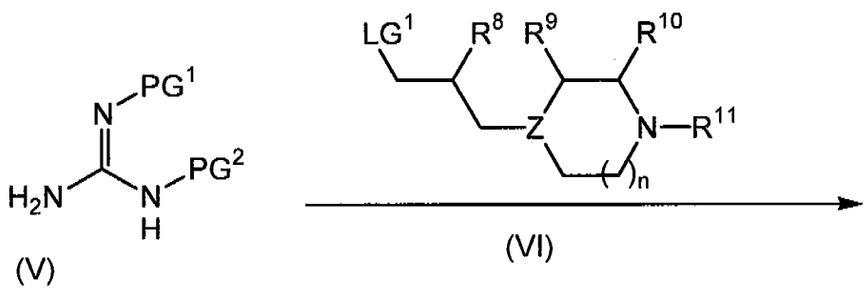
R^8 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno y alquilo de C_{1-4};

Z se selecciona del grupo que consiste de N y CH;

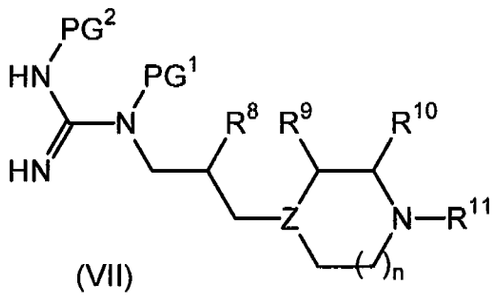
n es 1 ó 2;

R^9, R^{10} y R^{11} se seleccionan, independientemente, del grupo que consiste de hidrógeno y alquilo de C_{1-4};

y sales farmacéuticamente aceptables de éstos, el proceso comprende

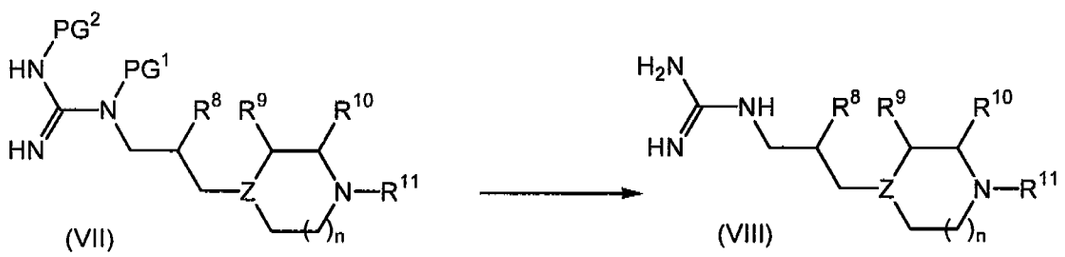


(V) (VI)



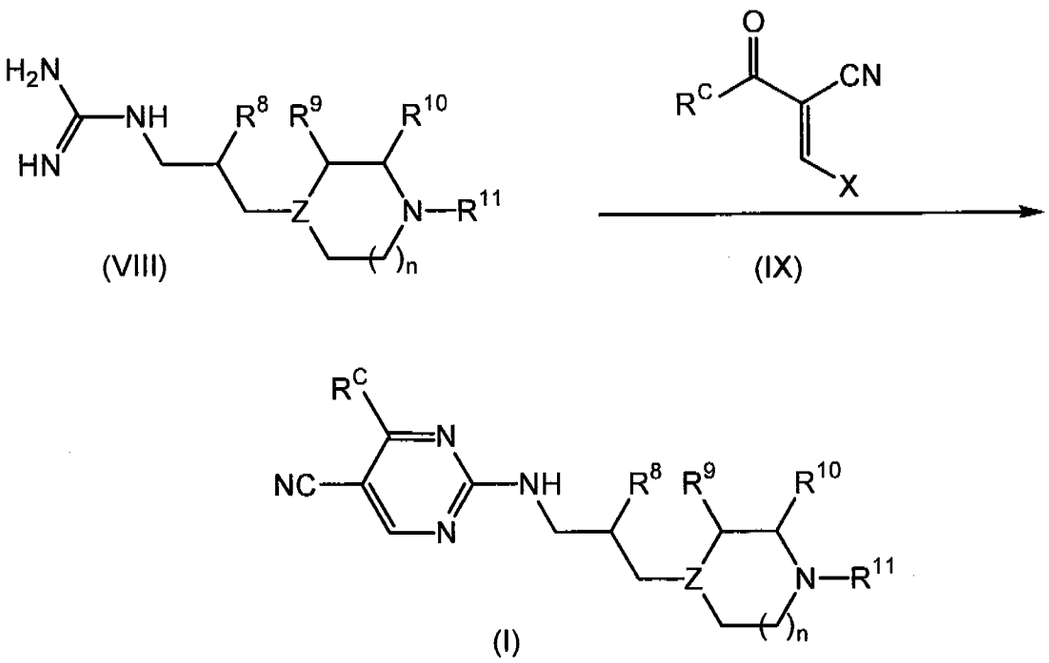
(VII)

reaccionar un compuesto de la Fórmula (V), en donde PG^1 y PG^2 son cada uno independientemente un grupo de protección del nitrógeno, con un compuesto de la Fórmula (VI), en donde LG^1 es un grupo de salida, en un primer solvente orgánico; y cuando LG^1 es –OH, en presencia de un sistema de agentes de acoplamiento; para producir el compuesto correspondiente de la Fórmula (VII);



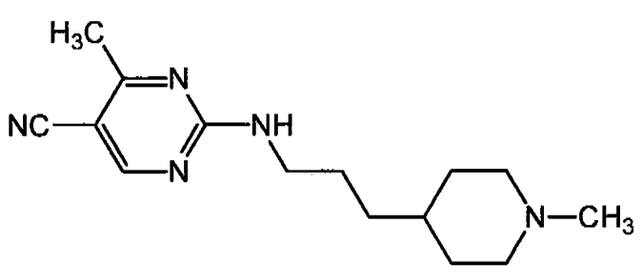
(VII) (VIII)

desproteger el compuesto con la Fórmula (VII), para producir el compuesto correspondiente con la Fórmula (VIII); y



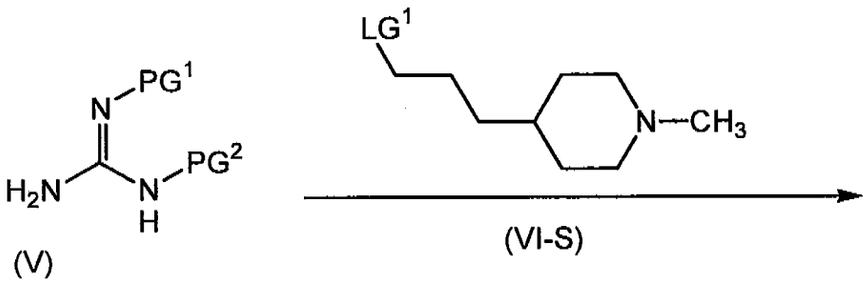
reaccionar el compuesto de la Fórmula (VIII) con un compuesto de la Fórmula (IX), en un segundo solvente orgánico, para producir el compuesto correspondiente de la Fórmula (I), en donde X se selecciona del grupo que consiste de $-N(R^{20})_2$ y $-OR^{21}$; en donde cada R^{20} se selecciona, independientemente, del grupo que consiste de alquilo de C_{1-4}; alternativamente los dos grupos R^{20} se toman juntos con el átomo de nitrógeno al cual están unidos para formar una estructura anular saturada seleccionada del grupo que consiste de piperidinilo, pirrolidinil y morfolinilo; y en donde R^{21} se selecciona del grupo que consiste de alquilo de C_{1-4} y bencilo.

2. Un proceso para preparar un compuesto de Fórmula (I-S)

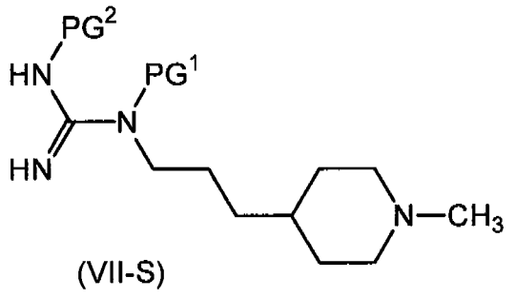


(I-S),

que comprende

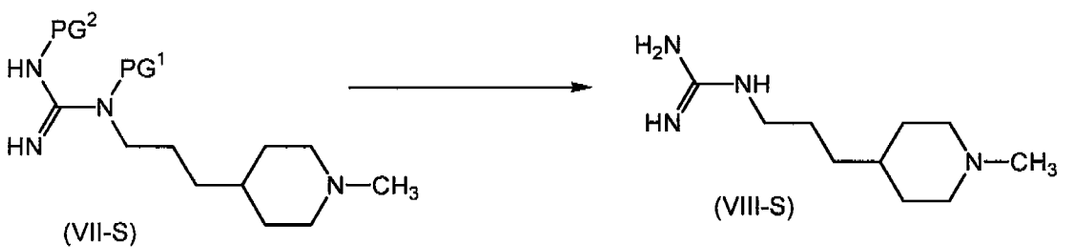


(V) (VI-S)



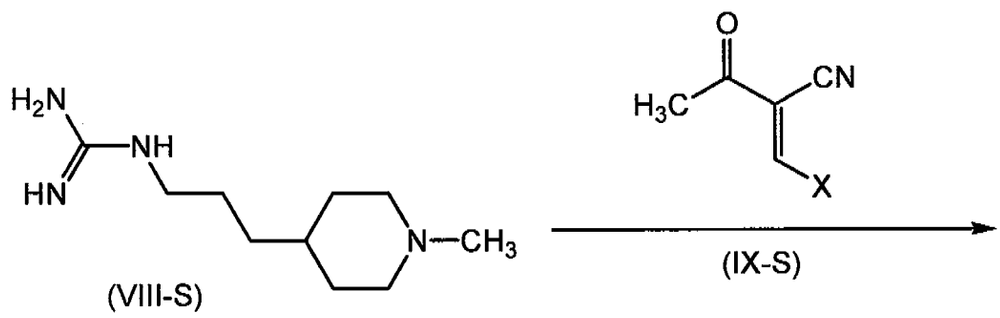
(VII-S)

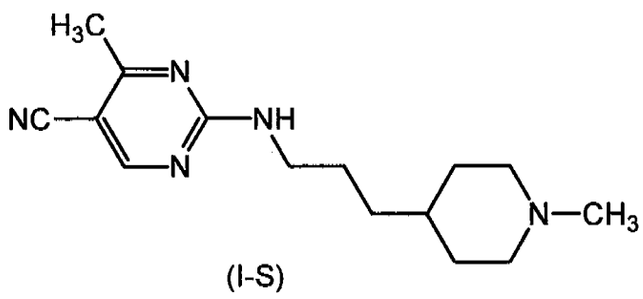
reaccionar un compuesto de la Fórmula (V), en donde PG^1 y PG^2 son cada uno, independientemente, un grupo de protección del nitrógeno, con un compuesto de la Fórmula (VI-S), en donde LG^1 es un grupo de salida, en un primer solvente orgánico; y cuando LG^1 es –OH, en presencia de un sistema de agentes de acoplamiento; para producir el compuesto correspondiente de la Fórmula (VII-S);



(VII-S) (VIII-S)

desproteger el compuesto con la Fórmula (VII-S), para producir el compuesto correspondiente con la Fórmula (VIII-S); y





reaccionar el compuesto de la Fórmula (VIII-S) con un compuesto de la Fórmula (IX-S), en un segundo solvente orgánico, para producir el compuesto correspondiente de la Fórmula (I-S), en donde X se selecciona del grupo que consiste de $-N(R^{20})_2$ y $-OR^{21}$; en donde cada R^{20} se selecciona, independientemente, del grupo que consiste de alquilo de C_{1-4}; alternativamente los dos grupos R^{20} se toman juntos con el átomo de nitrógeno al cual están unidos para formar una estructura anular saturada seleccionada del grupo que consiste de piperidinilo, pirrolidinil y morfolinilo; y en donde R^{21} se selecciona del grupo que consiste de alquilo de C_{1-4} y bencilo.

3. Un proceso de acuerdo con la reivindicación 2, en donde PG^1 y PG^2 son cada uno CBz.

4. Un proceso de acuerdo con la reivindicación 2, en donde el compuesto de la Fórmula (VI-S) LG^1 es hidroxi.

5. Un proceso de acuerdo con la reivindicación 2, en donde el compuesto de la Fórmula (VI-S) está presente en una cantidad de aproximadamente 1,0 equivalentes molares.

6. Un proceso de acuerdo con la reivindicación 2, en donde el sistema de agente de acoplamiento es DIAD y PPh_3; y en donde el sistema de agente de acoplamiento está presente en una cantidad de aproximadamente 1,2 equivalentes molares.

7. Un proceso de acuerdo con la reivindicación 2, en donde el primer solvente orgánico es 2-metil-THF.

8. Un proceso de acuerdo con la reivindicación 2, en donde el compuesto de la Fórmula (V-S) reacciona con el compuesto de la Fórmula (VI-S) a aproximadamente 5°C.

9. Un proceso de acuerdo con la reivindicación 2, en donde el compuesto de la Fórmula (VII-S) se desprotege al reaccionar el compuesto de la Fórmula (VII-S) con gas hidrógeno en presencia de catalizador de Pd/C.

10. Un proceso de acuerdo con la reivindicación 2, en donde el compuesto de la Fórmula (IX-S), X es $-N(CH_3)_2$.

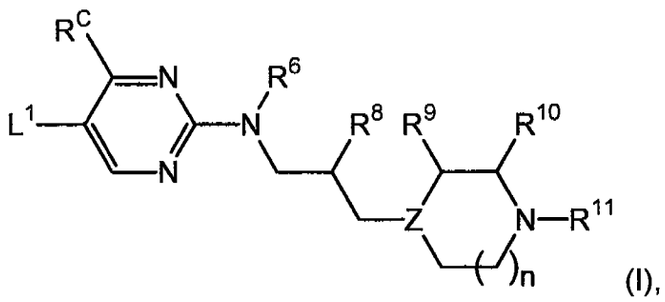
11. Un proceso de acuerdo con la reivindicación 2, en donde el compuesto de la Fórmula (IX-S) está presente en una cantidad de aproximadamente 1,5 equivalentes molares.

12. Un proceso de acuerdo con la reivindicación 2, en donde el segundo solvente orgánico es etanol.

13. Un proceso de acuerdo con la reivindicación 2, en donde el compuesto de la Fórmula (VIII-S) reacciona con el compuesto de la Fórmula (IX-S) a aproximadamente la temperatura de reflujo.

14. Un compuesto preparado de acuerdo con el proceso de la reivindicación 2.

15. Un proceso para preparar un compuesto de Fórmula (I)



(I),

en donde

L^1 es CN;

R^c se selecciona del grupo que consiste de H, metilo, etilo, propilo, isopropilo, $-CF_3$, ciclopropilo, y ciclobutilo;

R^6 es hidrógeno;

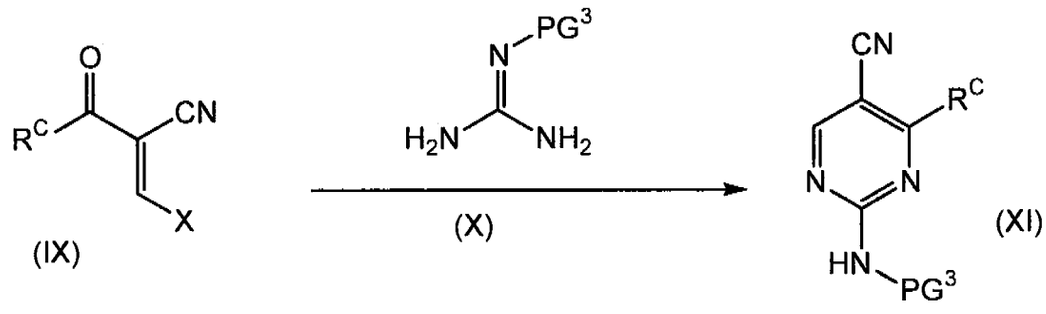
R^8 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno y alquilo de C_{1-4};

Z se selecciona del grupo que consiste de N y CH;

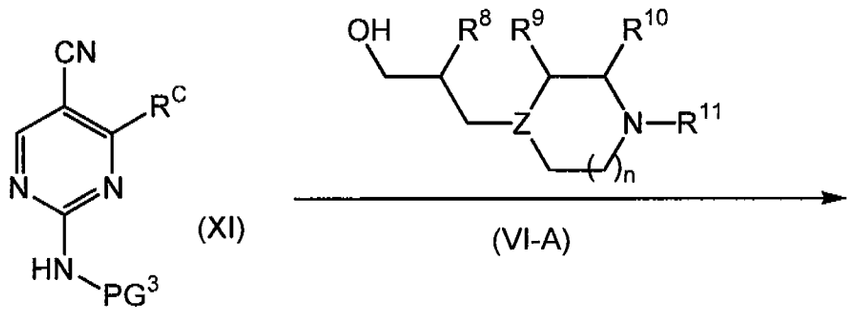
n es 1 ó 2;

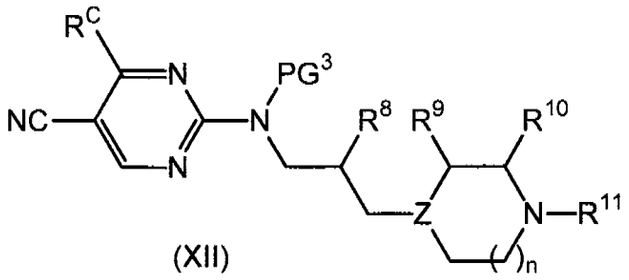
R^9, R^{10} y R^{11} se seleccionan, independientemente, del grupo que consiste de hidrógeno y alquilo de C_{1-4};

y sales farmacéuticamente aceptables de éstos; que comprende:

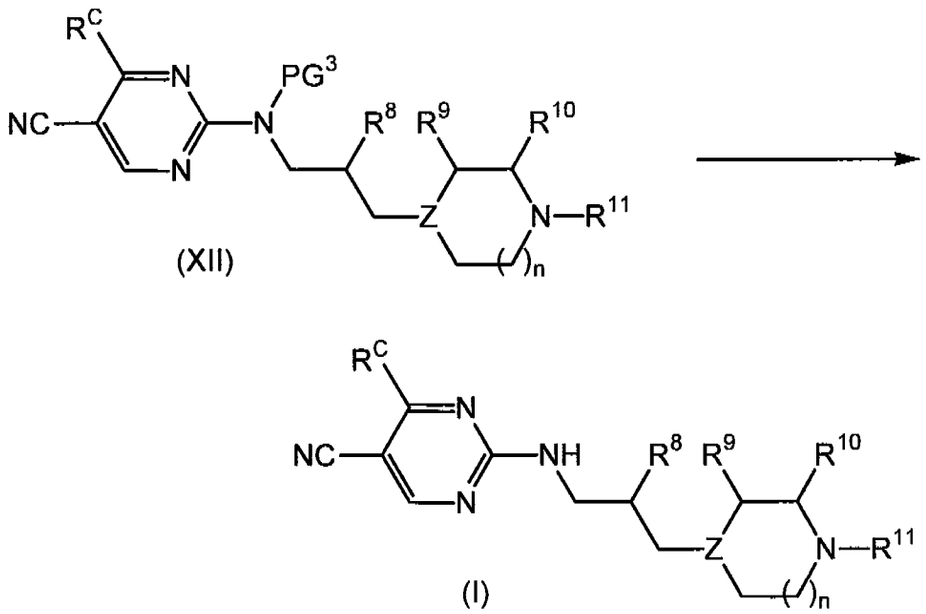


reaccionar un compuesto de la Fórmula (IX) en donde X se selecciona del grupo que consiste de $-N(R^{20})_2$ y $-OR^{21}$; en donde cada R^{20} se selecciona, independientemente, del grupo que consiste de alquilo de C_{1-4}; alternativamente, los dos grupos R^{20} se toman juntos con el átomo de nitrógeno al cual están unidos para formar una estructura anular saturada seleccionada del grupo que consiste de piperidinilo, pirrolidinil y morfolinilo; y en donde R^{21} se selecciona del grupo que consiste de alquilo de C_{1-4} y bencilo; con un compuesto de la Fórmula (X), en donde PG^3 es un grupo de protección del nitrógeno, en un primer solvente orgánico, para producir el compuesto correspondiente de la Fórmula (XI);





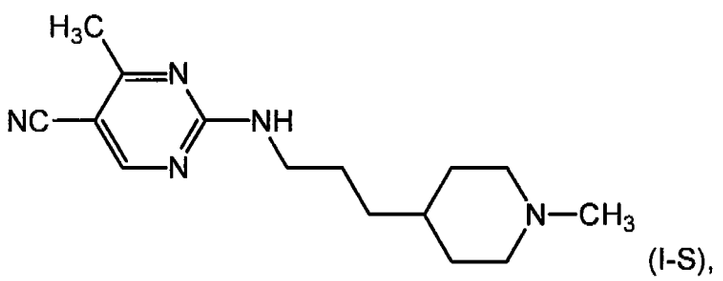
reaccionar el compuesto de la Fórmula (XI) con un compuesto de la Fórmula (VI-A), en presencia de un sistema de agentes de acoplamiento, en un segundo solvente orgánico, para producir el compuesto correspondiente de la Fórmula (XII); y



(XII) (I)

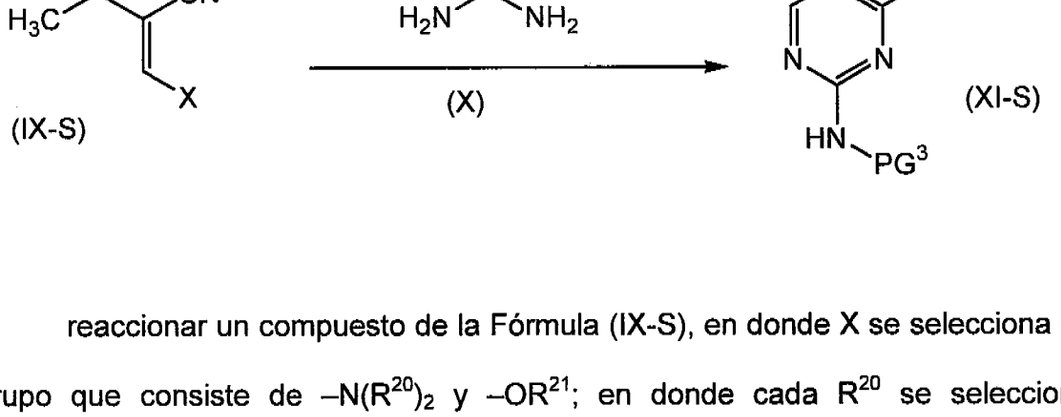
desproteger el compuesto de Fórmula (XII) para producir el compuesto correspondiente de Fórmula (I).

16. Un proceso para preparar un compuesto de Fórmula (I-S)

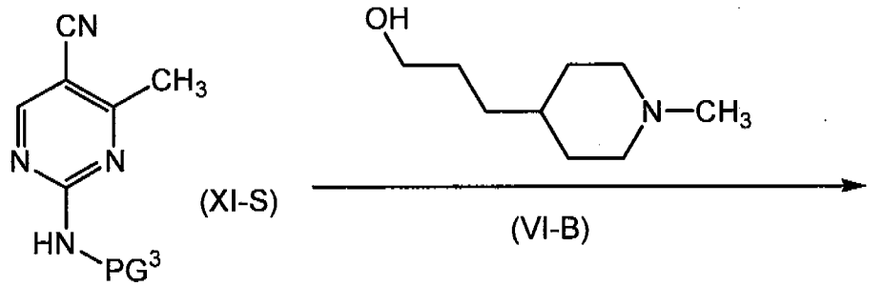


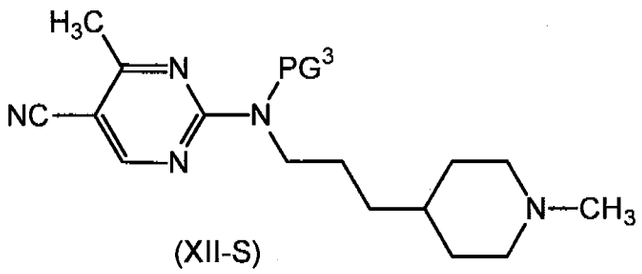
(I-S),

que comprende:

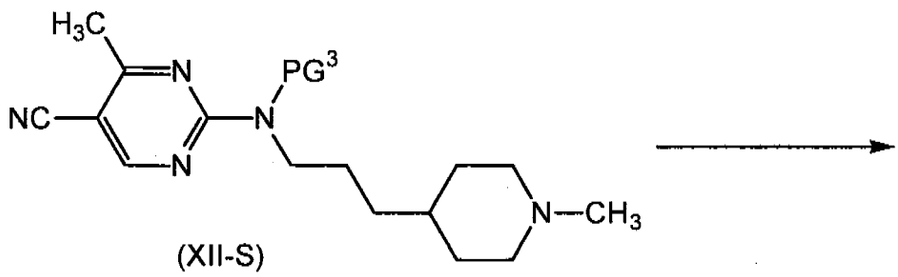


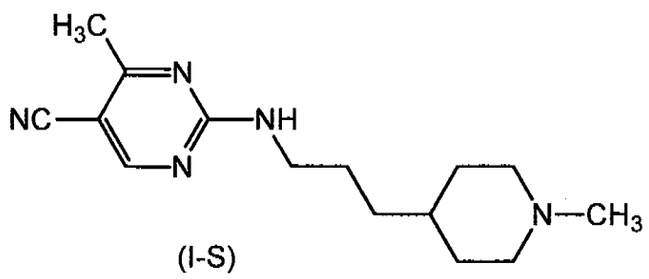
reaccionar un compuesto de la Fórmula (IX-S), en donde X se selecciona del grupo que consiste de $-N(R^{20})_2$ y $-OR^{21}$; en donde cada R^{20} se selecciona, independientemente, del grupo que consiste de alquilo de C_{1-4}; alternativamente los dos grupos R^{20} se toman juntos con el átomo de nitrógeno al cual están unidos para formar una estructura anular saturada seleccionada del grupo que consiste de piperidinilo, pirrolidinil y morfolinilo; y en donde R^{21} se selecciona del grupo que consiste de alquilo de C_{1-4} y bencilo; con un compuesto de la Fórmula (X), en donde PG^3 es un grupo de protección del nitrógeno, en un primer solvente orgánico, para producir el compuesto correspondiente de la Fórmula (XI-S);





reaccionar el compuesto de la Fórmula (XI-S) con un compuesto de la Fórmula (VI-B), en presencia de un sistema de agentes de acoplamiento, en un segundo solvente orgánico, para producir el compuesto correspondiente de la Fórmula (XII-S); y





desproteger el compuesto de Fórmula (XII-S) para producir el compuesto de Fórmula (I-S) correspondiente.

17. Un proceso de acuerdo con la reivindicación 16, en donde PG^3 se selecciona del grupo que consiste de $-C(O)CH_3$, $-C(O)OCH_2CH_3$, –C(O)O-t-butilo, -CHO, $-C(O)OCH_3$, $-C(O)O-CH_2$-fenilo, -C(O)-fenilo, $-C(O)OCH_2CCl_3$, -C(O)-(4-nitrofenilo), $-C(O)CCl_3$, $-C(O)CF_3$, $-SO_2CH_3$, $-SO_2$-fenilo, $-SO_2$-(4-nitrofenilo) y $-SO_2CF_3$.

18. Un proceso de acuerdo con la reivindicación 16, en donde PG^3 se selecciona del grupo que consiste de $-C(O)CH_3$, $-C(O)OCH_2CH_3$ y -C(O)O-t-butilo.

19. Un proceso de acuerdo con la reivindicación 16, en donde PG^3 se selecciona del grupo que consiste de $-C(O)OCH_2CH_3$ y -C(O)O-t-butilo.

20. Un proceso de acuerdo con la reivindicación 16, en donde el compuesto de la Fórmula (IX-S), X es $-N(CH_3)_2$.

21. Un proceso de acuerdo con la reivindicación 16, en donde el compuesto de la Fórmula (IX-S) está presente en una cantidad de aproximadamente 1,5 equivalentes molares.

22. Un proceso de acuerdo con la reivindicación 16, en donde el primer solvente orgánico es 2-metil-THF.

23. Un proceso de acuerdo con la reivindicación 16, en donde el compuesto de la Fórmula (IX-S) reacciona con el compuesto de la Fórmula (X) a aproximadamente 80 °C.

24. Un proceso de acuerdo con la reivindicación 16, en donde el compuesto de la Fórmula (VI-B) está presente en una cantidad de aproximadamente 1,5 equivalentes molares.

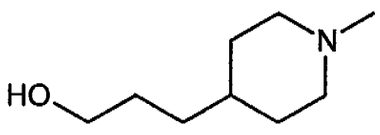
25. Un proceso de acuerdo con la reivindicación 16, en donde el sistema de agente de acoplamiento es DIAD y PPh_3; y en donde el sistema de agente de acoplamiento está presente en una cantidad de aproximadamente 1,2 equivalentes molares.

26. Un proceso de acuerdo con la reivindicación 16, en donde el segundo solvente orgánico es 2-metil-THF.

27. Un proceso de acuerdo con la reivindicación 16, en donde el compuesto de la Fórmula (XI-S) reacciona con el compuesto de la Fórmula (VI-B) a una temperatura de aproximadamente 5 °C.

28. Un compuesto preparado de acuerdo con el proceso de la reivindicación 16.

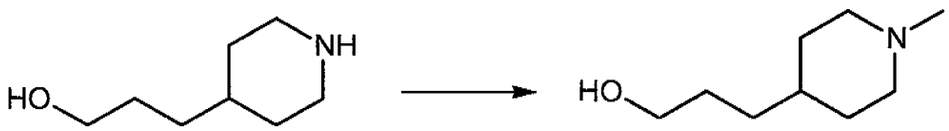
29. Un proceso para la preparación de un compuesto de la Fórmula (VI-S)



(VI-S),

que comprende:

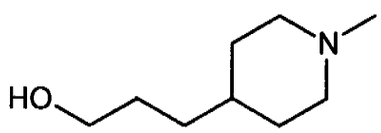
reaccionar 4-piridinepropanol con gas hidrógeno, en presencia de Pd/C, en una mezcla 3:1 de metanol:ácido acético, para producir 4-piperidinapropanol; y



(VI-S)

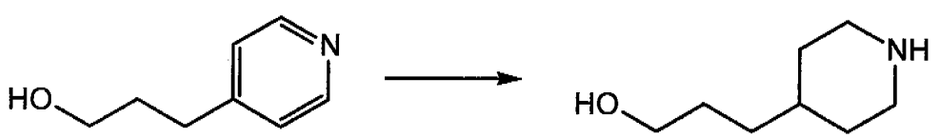
reaccionar 4-piperidinapropanol con formaldehído, en presencia de gas hidrógeno, en una mezcla 3:1 de metanol: ácido acético, para producir el compuesto de la Fórmula (VI-S).

30. Un proceso para la preparación de un compuesto de la Fórmula (VI-S)

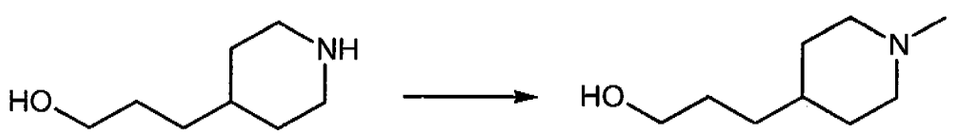


(VI-S),

que comprende



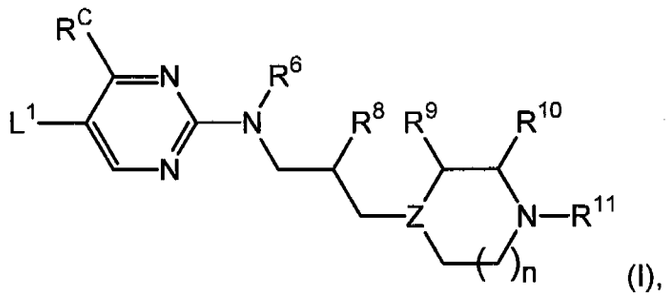
reaccionar 4-piridinepropanol con gas hidrógeno, en presencia de 5 % catalizador Rh/C, en agua, para producir 4-piperidinapropanol; y



(VI-S)

reaccionar 4-piperidinapropanol con formaldehído, en presencia de gas hidrógeno, en agua, para producir el compuesto de la Fórmula (VI-S).

31. Un compuesto de Fórmula (I)



(I),

en donde

L^1 es CN;

R^c se selecciona del grupo que consiste de H, metilo, etilo, propilo, isopropilo, $-CF_3$, ciclopropilo, y ciclobutilo;

R^6 es hidrógeno;

R^8 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno y alquilo de C_{1-4};

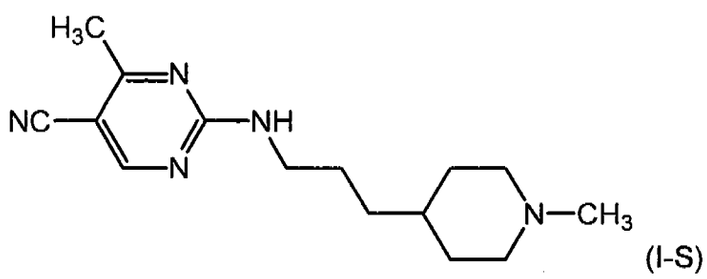
Z se selecciona del grupo que consiste de N y CH;

n es 1 ó 2;

R^9, R^{10} y R^{11} se seleccionan, independientemente, del grupo que consiste de hidrógeno y alquilo de C_{1-4};

o una sal farmacéuticamente aceptable de éstos.

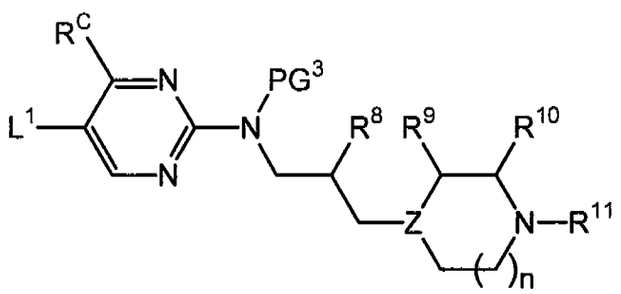
32. Un compuesto de la Fórmula (I-S)



(I-S)

o una sal farmacéuticamente aceptable de éstos.

33. Un compuesto de Fórmula (XII)



(XII),

en donde

PG^3 es un grupo protector de nitrógeno;

L^1 es CN;

R^c se selecciona del grupo que consiste de H, metilo, etilo, propilo, isopropilo, $-CF_3$, ciclopropilo, y ciclobutilo;

R^8 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno y alquilo de C_{1-4};

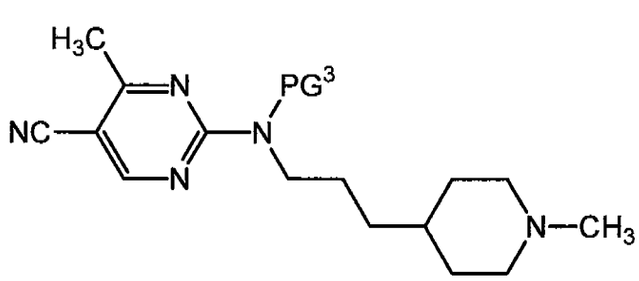
Z se selecciona del grupo que consiste de N y CH;

n es 1 ó 2;

R^9, R^{10} y R^{11} se seleccionan, independientemente, del grupo que consiste de hidrógeno y alquilo de C_{1-4};

o sales farmacéuticamente aceptables de éstos.

34. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 33, en donde el compuesto de la Fórmula (XII) es un compuesto de la Fórmula (XII-S)

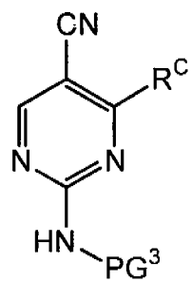


(XII-S)

o una sal farmacéuticamente aceptable de éstos.

35. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 34, en donde PG^3 se selecciona del grupo que consiste de $-C(O)OCH_2CH_3$ y $-C(O)OC(CH_3)_3$.

36. Un compuesto de la Fórmula (XI)



(XI),

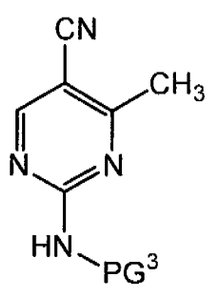
en donde

PG^3 es un grupo protector de nitrógeno;

R^c se selecciona del grupo que consiste de H, metilo, etilo, propilo, isopropilo, $-CF_3$, ciclopropilo, y ciclobutilo;

o una sal farmacéuticamente aceptable de éstos.

37. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 36, en donde el compuesto de la Fórmula (XI) es un compuesto de la Fórmula (XI-S)

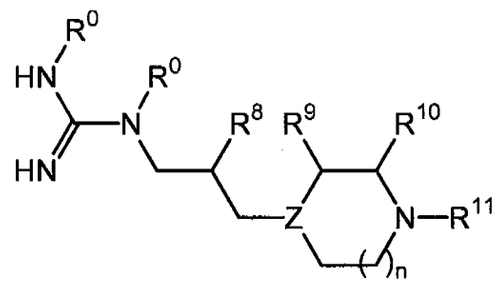


(XI-S)

o una sal farmacéuticamente aceptable de éstos.

38. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 37, en donde PG^3 se selecciona del grupo que consiste de $-C(O)OCH_2CH_3$ y $-C(O)OC(CH_3)_3$.

39. Un compuesto de la Fórmula (XX)



(XX),

en donde

cada R^0 es hidrógeno o un grupo de protección del nitrógeno; y en donde los dos grupos R^0 son los mismos;

R^8 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno y alquilo de C_{1-4};

Z se selecciona del grupo que consiste de N y CH;

n es 1 ó 2;

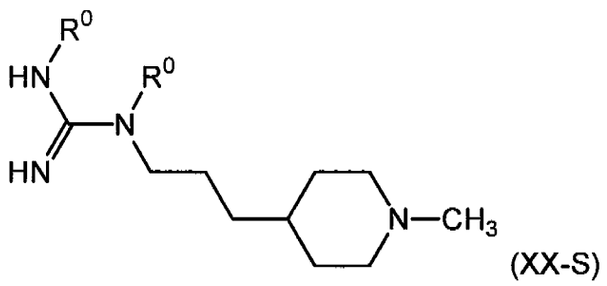
R^9, R^{10} y R^{11} se seleccionan, independientemente, del grupo que consiste de hidrógeno y alquilo de C_{1-4};

siempre que cada uno de R^8, R^9 y R^{10} sea hidrógeno, n sea 1 ó 2, y R^{11} sea metilo, entonces R^0 es un grupo de protección del nitrógeno distinto que $-C(O)O-CH_3$; (es decir, R^0 no es hidrógeno o $-C(O)OCH_3$);

o una sal farmacéuticamente aceptable de éstos.

40. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 39, en donde Z es CH.

41. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 39, en donde el compuesto de la Fórmula (XX) es un compuesto de la Fórmula (XX-S)



(XX-S)

o una sal farmacéuticamente aceptable de éstos.

42. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 41, en donde cada R^0 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno y benciloxicarbonilo (CBz); y en donde los dos grupos R^0 son los mismos.