



Industria y Comercio  
SUPERINTENDENCIA



No. 11-011423- -00005-0000

Fecha: 2011-10-10 17:23:30 Dep. 2020 DIR.NUEVASOR  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI  
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 10

## FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

P2011/000023

### SOLICITUD DE:

1

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Solicitud.

2

SOLICITANTE  
(71)

Nombre: ASTRAZENECA AB

Dirección: S-151- 85 Södertälje

Nacionalidad Domicilio: Suecia

Lugar de Constitución: Suecia

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:  
11-011.423

5

Descripción de la corrección o modificación solicitada Se Eliminaron las  
Reivindicaciones 11 a 16 y 20.

6

Comprobante de pago No. 11-

Fecha Octubre de 2011

7

### Anexos

☒

Comprobante de pago de la tasa de modificaciones en trámite \$118.000

Comprobante de pago de la tasa de 2 reivindicaciones adicionales \$108.000

☐

Capítulo Reivindicatorio Modificado.

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  
- / -



RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0099019

Bogotá D.C., Octubre 07 de 2011 - 15:54:24

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 | 408398620 | 07/10/2011 | 3.748.000.00 |

\*\*\* Conceptos Pagados \*\*\*

| CANT. | RENTISTICO                                          | CONCEPTO                           | Vr. UNIDITARIO | Vr. CONCEPTO |
|-------|-----------------------------------------------------|------------------------------------|----------------|--------------|
| 1     | 50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL | 99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS | 226.000.00     | 226.000.00   |
|       |                                                     |                                    |                | \$226.000.00 |

SON: \*\*DOSCIENTOS VEINTISEIS MIL PESOS MONEDA CORRIENTE\*\*

Responsable: \_\_\_\_\_

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. \_\_\_\_\_

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO  
No. 11-011423- -00005-0000  
Fecha: 2011-10-10 17:23:30 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI  
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 10

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

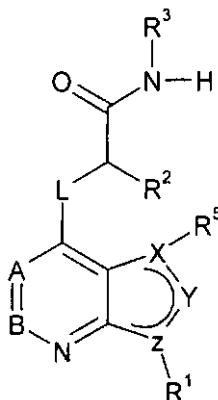
Web: www.sic.gov.co e-mai: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Línea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

Octubre 7 de 2011 - 15:54:25

## CAPITULO REIVINDICATORIO MODIFICADO

### (Modificaciones Voluntarias)

1. Un compuesto de Fórmula (I):



(I)

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo en donde:

A y B son cada uno N o CR<sup>6</sup>, siempre que al menos uno de A y B sea CR<sup>6</sup>;

X es C o N;

Y es CH o N;

Z es C o N;

en donde X, Y y Z se seleccionan de forma tal que al menos dos de X, Y y Z son N, el anillo que los contiene es aromático y ningún átomo de nitrógeno del anillo está cuaternizado;

R<sup>1</sup> es alquilo(C<sub>1-6</sub>), arilo, arilalquilo(C<sub>1-6</sub>) o HET-1 en donde el arilo, arilalquilo(C<sub>1-6</sub>) y HET-1 están opcionalmente sustituidos por uno, dos o tres grupos que se seleccionan independientemente de halo, alquilo(C<sub>1-4</sub>), alcoxi(C<sub>1-4</sub>), trifluorometilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)tio, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfinilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfonilo, ciano, carboxi, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)carbonilo, carbamoilo, N-alquil(C<sub>1-4</sub>)carbamoilo, N,N-dialquil(C<sub>1-4</sub>)carbamoilo, aminosulfinilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)aminosulfinilo, dialquil(C<sub>1-6</sub>)aminosulfinilo, alcanoil(C<sub>1-4</sub>)amino, hidroxialquilo(C<sub>1-4</sub>), alcoxi(C<sub>1-4</sub>)alquilo(C<sub>1-4</sub>), alquil(C<sub>1-4</sub>)S(O)palquilo(C<sub>1-4</sub>), aminoalquilo(C<sub>1-4</sub>), alquil(C<sub>1-4</sub>)aminoalquilo(C<sub>1-4</sub>), dialquil(C<sub>1-4</sub>)aminoalquilo(C<sub>1-4</sub>), alcoxi(C<sub>1-6</sub>)carbonilalquilo(C<sub>1-4</sub>)-, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfinilo, cicloalquil(C<sub>3-6</sub>)sulfonilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfonilamino, azetidilcarbonilo, pirrolidinilcarbonilo y HET-3A;

en donde HET-1 es un anillo heteroarilo unido a C de 5 ó 6 miembros, o un sistema de anillos bicíclico fusionado de Fórmula -D-E,

en donde el anillo D está unido a Z y es un anillo arilo o heteroarilo de 6 miembros y un anillo E es un anillo heteroarilo, heterociclilo o cicloalquilo de 5 o 6 miembros que está fusionado al anillo D en cualquier posición disponible;

R<sup>2</sup> es alquilo(C<sub>1-6</sub>) opcionalmente sustituido por uno o dos hidroxilo o por uno de los

siguientes: carboxi, carbamoilo, *N,N*-dialquil(C<sub>1-4</sub>)carbamoilo, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)carbonilo, un grupo -N(R<sup>7</sup>)COR<sup>8</sup> o un grupo NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>;

o R<sup>2</sup> es un grupo -(CHR<sup>4</sup>)<sub>n</sub>-P-Q en donde n es 1, 2, 3 ó 4;

P es un enlazante que se selecciona de O, SO<sub>2</sub>, CONH y NHCO;

Q se selecciona de alquilo(C<sub>1-6</sub>), cicloalquilo(C<sub>3-6</sub>) y un heterocíclico de 4, 5 o 6 miembros (en donde dicho anillo heterocíclico contiene 1, 2 o 3 heteroátomos que se seleccionan independientemente de O, N y S, siempre que no haya enlaces O-O, S-S ni O-S, en donde un átomo de carbono disponible en el anillo puede oxidarse para convertirse en un grupo carbonilo, un átomo de azufre disponible en el anillo puede oxidarse para convertirse en un grupo SO o SO<sub>2</sub> y en donde opcionalmente hay un enlace doble en el anillo) y Q está opcionalmente sustituido en un átomo de carbono disponible por hidroxilo o alcoxi(C<sub>1-4</sub>);

R<sup>3</sup> es un grupo HET-2 en donde HET-2 es un anillo heteroarilo monocíclico unido a C de 5 ó 6 miembros, que contiene un átomo de nitrógeno en la posición 2 y opcionalmente 1 ó 2 heteroátomos del anillo adicionales que se seleccionan independientemente de O, N y S; o HET-2 es un anillo heteroarilo bicíclico unido a C de 8, 9 o 10 miembros que contiene un átomo de nitrógeno en la posición 2 con hasta cinco heteroátomos del anillo adicionales que se seleccionan independientemente de O, N y S;

en donde HET-2 está opcionalmente sustituido en un átomo de carbono disponible, o en un átomo de nitrógeno del anillo siempre que no quede de este modo cuaternizado, con 1 ó 2 sustituyentes que se seleccionan independientemente de R<sup>11</sup>;

cada R<sup>4</sup> se selecciona independientemente de hidrógeno, hidroxilo, metilo y etilo; siempre que cuando n es >1, entonces no más de dos grupos R<sup>4</sup> son hidroxilo;

R<sup>5</sup> es H, alcoxi(C<sub>1-4</sub>) o alquilo(C<sub>1-4</sub>);

R<sup>6</sup> es H, alcoxi(C<sub>1-4</sub>) o alquilo(C<sub>1-4</sub>);

R<sup>7</sup> es H o alquilo(C<sub>1-4</sub>);

R<sup>8</sup> es alquilo(C<sub>1-4</sub>);

R<sup>9</sup> es H o alquilo(C<sub>1-4</sub>) opcionalmente sustituido por hidroxilo o metoxilo;

R<sup>10</sup> es H o alquilo(C<sub>1-4</sub>);

o -NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup> forma una azetidina opcionalmente sustituida por hidroxilo;

R<sup>11</sup> se selecciona independientemente de halo, alquilo(C<sub>1-4</sub>), alcoxi(C<sub>1-4</sub>), trifluorometilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)tio, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfinilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfonilo, ciano, carboxi, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)carbonilo, carbamoilo, *N*-alquil(C<sub>1-4</sub>)carbamoilo, *N,N*-dialquil(C<sub>1-4</sub>)carbamoilo, aminosulfonilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)aminosulfonilo, dialquil(C<sub>1-6</sub>)aminosulfonilo, alcanoil(C<sub>1-4</sub>)amino, hidroxialquilo(C<sub>1-4</sub>), alcoxi(C<sub>1-4</sub>)alquilo(C<sub>1-4</sub>), alquil(C<sub>1-4</sub>)S(O)palquilo(C<sub>1-4</sub>) (en donde p es 0, 1 o 2), aminoalquilo(C<sub>1-4</sub>), alquil(C<sub>1-4</sub>)aminoalquilo(C<sub>1-4</sub>), dialquil(C<sub>1-4</sub>)aminoalquilo(C<sub>1-4</sub>), alcoxi(C<sub>1-6</sub>)carbonilalquilo(C<sub>1-4</sub>)-, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfoniloxi, cicloalquil(C<sub>3-6</sub>)sulfonilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfonilamino, azetidilcarbonilo,

pirrolidinilcarbonilo y HET-3;

HET-3 y HET-3A son cada uno independientemente un anillo heteroarilo insustituido unido a C o N de 5 o 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos del anillo que se seleccionan independientemente de O, N y S, o un anillo heterociclilo saturado insustituido unido a C o N de 4, 5 o 6 miembros que contiene un heteroátomo del anillo que se selecciona de O, N y S;

L es S, O o NR<sup>12</sup>; y

R<sup>12</sup> es H o alquilo(C<sub>1-4</sub>);

pero excluyendo

N-(5-cloro-2-piridinil)-2-[(1-fenil-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidin-4-il)tio]propanamida;

N-[1-(1-metiletil)-1H-pirazol-5-il]-2-[(1-fenil-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidin-4-il)tio]propanamida,

N-(5-(metil)isoxazol-3-il)-2-[[1-(4-fluorofenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidin-4-il]tio]butanamida;

N-(5-(metil)isoxazol-3-il)-2-[[1-(4-fluorofenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidin-4-il]tio]propanamida;

(2R)-2-[1-(3-cloro-2-piridil)pirazolo[4,5-e]pirimidin-4-il]oxi-5-hidroxi-N-(5-metil-2-piridil)pentanamida;

(2R)-N-(5-cloro-2-piridil)-2-[1-(3-cloro-2-piridil)pirazolo[4,5-e]pirimidin-4-il]oxi-5-hidroxi-pentanamida;

(2S)-2-[1-(3-cloro-2-piridil)pirazolo[4,5-e]pirimidin-4-il]oxi-N-(5-ciano-2-piridil)-3-[(1S)-2-hidroxi-1-metil-etoxi]propanamida;

(2R)-2-[1-(2-clorofenil)pirazolo[4,5-e]pirimidin-4-il]oxi-N-(5-ciano-2-piridil)-3-(2-hidroxietoxi)propanamida;

(2S)-N-(5-ciano-2-piridil)-2-[1-(2,5-dimetilfenil)pirazolo[4,5-e]pirimidin-4-il]oxi-3-(2-hidroxietoxi)propanamida;

(2S)-3-(2-hidroxietoxi)-N-(5-metil-2-piridil)-2-(9-fenilpurin-6-il)oxi-propanamida;

(2R)-2-[1-(2-clorofenil)pirazolo[4,5-e]pirimidin-4-il]oxi-N-(5-fluoro-2-piridil)-3-(2-hidroxietoxi)propanamida;

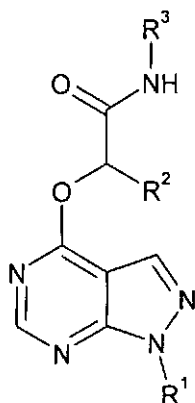
(2S)-N-(5-cloro-2-piridil)-2-[1-(3-cloro-2-piridil)pirazolo[4,5-e]pirimidin-4-il]oxi-3-[(2R)-2-hidroxipropoxi]propanamida;

(2R)-N-(5-cloro-2-piridil)-2-[1-(3-cloro-2-piridil)pirazolo[4,5-e]pirimidin-4-il]oxi-3-[(2R)-2-hidroxipropoxi]propanamida;

(2S)-2-[1-(3-cloro-2-piridil)pirazolo[4,5-e]pirimidin-4-il]oxi-N-(5-ciano-2-piridil)-3-(3-hidroxiciclobutoxi)propanamida; y

(2S)-N-(5-cloro-2-piridil)-2-[1-(3-cloro-2-piridil)pirazolo[4,5-e]pirimidin-4-il]oxi-3-(3-hidroxiciclobutoxi)propanamida.

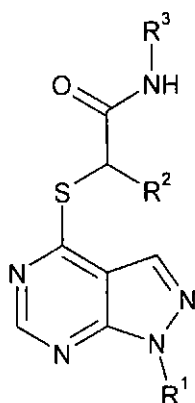
2. Un compuesto de Fórmula (I) como se reivindica en la Reivindicación 1, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, que es un compuesto de Fórmula (IA)



(IA)

en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> son tal como se definen en Reivindicación 1.

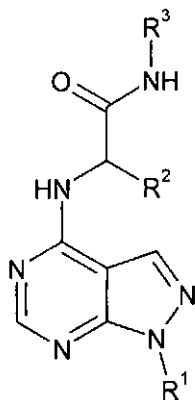
3. Un compuesto de Fórmula (I) como se reivindica en la Reivindicación 1, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, que es un compuesto de Fórmula (IB)



(IB)

en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> son tal como se definen en Reivindicación 1.

4. Un compuesto de Fórmula (I) como se reivindica en la Reivindicación 1, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, que es un compuesto de Fórmula (IC).



(IC)

en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> son tal como se definen en Reivindicación 1.

5. Un compuesto de Fórmula (I) como se reivindica en la Reivindicación 1 o la Reivindicación 2, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde

$R^1$  es HET-1 opcionalmente sustituido por uno o dos sustituyentes que se seleccionan independientemente de halo (particularmente cloro), alquilo( $C_{1-4}$ ), alcoxi( $C_{1-4}$ ), trifluorometilo, alquil( $C_{1-6}$ )sulfonilo y ciano.

6. Un compuesto de Fórmula (I) como se reivindica en la Reivindicación 1, la Reivindicación 2 o la Reivindicación 5, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde

$R^2$  es alquilo( $C_{1-6}$ ) opcionalmente sustituido por uno o dos hidroxilo o  $R^2$  es un grupo  $-(CHR^4)_n-P-Q$ ;

$n$  es 1, 2, 3 ó 4;

un  $R^4$  es opcionalmente hidroxilo y los otros grupos  $R^4$  (donde corresponda) son hidrógeno o metilo;

$P$  es un enlazante de oxígeno;

$Q$  es alquilo( $C_{1-6}$ ), cicloalquilo( $C_{3-6}$ ) o un heterociclilo de 4, 5 o 6 miembros y  $Q$  está opcionalmente sustituido en un átomo de carbono disponible por hidroxilo o alcoxi( $C_{1-4}$ ).

7. Un compuesto de Fórmula (I) como se reivindica en la Reivindicación 1, la Reivindicación 2, la Reivindicación 5 o la Reivindicación 6, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde

$R^3$  es piridilo, sustituido en la posición para con relación al punto de unión al grupo CONH con un sustituyente que se selecciona de halo, alquilo( $C_{1-4}$ ), alquil( $C_{1-6}$ )sulfonilo, N,N-dialquilcarbamoilo y ciano.

8. Un compuesto de la Fórmula (I) como se reivindica en la Reivindicación 1, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, que es un compuesto de los ejemplos de la presente, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

9. Un compuesto de la Fórmula (I) como se reivindica en la Reivindicación 1 que se selecciona de uno o más de los siguientes:

(2S)-N-(5-cloropiridin-2-il)-2-(1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazolo[3,4-d]-  
pirimidin-4-iloxi)-3-(3-hidroxiazetidín-1-il)propanamida;

(2S)-2-(1-(2-cloro-6-cianofenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidin-4-iloxi)-N-(5-  
cloropiridin-2-il)-3-(2-hidroxietoxi)propanamida;

(2S)-N-(5-cloropiridin-2-il)-2-(1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidin-  
4-iloxi)-3-((R)-1-hidroxipropan-2-iloxi)propanamida;

(2S)-2-[1-(2-clorofenil)pirazolo[4,5-e]pirimidin-4-il]oxi-N-(5-fluoro-2-piridil)-3-(3-hidroxiacetidin-1-il)propanamida;  
 (2S)-2-[1-(2-cloro-6-ciano-fenil)pirazolo[4,5-e]pirimidin-4-il]oxi-N-(5-cloro-2-piridil)-3-[(1R)-2-hidroxi-1-metil-etoxi]propanamida;  
 (2S)-2-[1-(2-cloro-6-ciano-fenil)pirazolo[4,5-e]pirimidin-4-il]oxi-3-[(1R)-2-hidroxi-1-metil-etoxi]-N-(5-metilpirazin-2-il)propanamida;  
 (2S)-2-[1-(2,6-diclorofenil)pirazolo[4,5-e]pirimidin-4-il]oxi-N-(5-fluoro-2-piridil)-3-(2-hidroxi-etoxi)propanamida;  
 (2S)-2-[1-(2-clorofenil)pirazolo[4,5-e]pirimidin-4-il]oxi-3-(3-hidroxiacetidin-1-il)-N-(5-metilpirazin-2-il)propanamida;  
 (2S)-2-[1-(2,6-diclorofenil)pirazolo[4,5-e]pirimidin-4-il]oxi-3-(3-hidroxiacetidin-1-il)-N-(5-metilpirazin-2-il)propanamida;  
 (2S)-2-[1-(2-clorofenil)pirazolo[3,4-d]pirimidin-4-il]oxi-N-(5-cloro-2-piridil)-3-(3-hidroxiacetidin-1-il)propanamida;  
 (2S)-2-[1-(2,6-diclorofenil)pirazolo[3,4-d]pirimidin-4-il]oxi-N-(5-fluoro-2-piridil)-3-(3-hidroxiacetidin-1-il)propanamida; y  
 (2S)-2-[1-(2-cloro-6-ciano-fenil)pirazolo[3,4-d]pirimidin-4-il]oxi-N-(5-fluoro-2-piridil)-3-(3-hidroxiacetidin-1-il)propanamida;  
 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

10. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 9, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, junto con un diluyente o portador farmacéuticamente aceptable.

11. Un proceso para la preparación de un compuesto de Fórmula (I) como se describe en la presente.

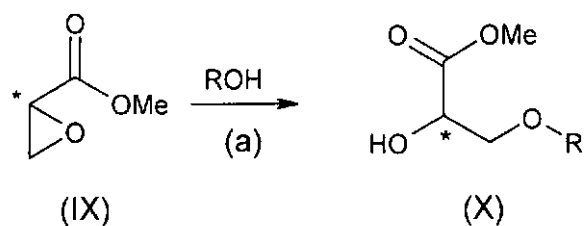
12. Una combinación farmacéutica que comprende un compuesto como se reivindica en cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 9 y otra sustancia farmacológicamente activa.

13. Una combinación farmacéutica como se reivindica en la Reivindicación 12 en donde la otra sustancia farmacológicamente activa es un medicamento para el tratamiento de la diabetes tipo 2.

14. La reacción de metil oxirano-2-carboxilato (IX) con un alcohol ROH (en donde R es alquilo(C<sub>1-6</sub>), cicloalquilo(C<sub>3-6</sub>) o R<sup>x</sup><sub>3</sub>SiO(2-4C)alquilo (en donde cada R<sup>x</sup> se selecciona independientemente de alquilo(C<sub>1-6</sub>) y fenilo) en presencia de

9

magnesiotrifluorometanosulfonato en acetato de etilo, para proporcionar un compuesto de Fórmula (X).



\*\*\*\*\*

## **ANEXO EXPLICATIVO DE LAS MODIFICACIONES**

- Se eliminan las Reivindicaciones 11 a 16 y 20.