



No. 11-028419- -00001-0000

Fecha: 2011-04-07 17:02:50 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 8

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y C
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. S. D.

Re: Expediente N°. 11-028.419

Solicitud de Patente de Invención titulada: "DERIVADOS DE PICOLINAMIDA
COMO INHIBIDORES DE QUINASA"

Solicitante: NOVARTIS AG

Nuestra Ref: P2011/000048

MEMORIAL DE ALCANCE

CARLOS R. OLARTE, mayor de edad y vecino de Bogotá, identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi carácter de apoderado de la sociedad en referencia, me permito informar lo siguiente:

1. El día 8 de marzo de 2011, se radicó la solicitud de patente en referencia con la traducción de las reivindicaciones corregidas. Me permito aclarar al Despacho que la numeración de las reivindicaciones en la solicitud internacional está mal numerada, siendo en total 30 reivindicaciones y no 28 reivindicaciones como erróneamente aparece en la publicación. Sin embargo con el fin de cumplir con los requisitos para la entrada en fase nacional colombiana me permito aportar nuevamente la traducción del Capítulo Reivindicatorio tal como fue publicado es decir con la numeración errónea.

Agradezco al Despacho la atención prestada.

Atentamente,

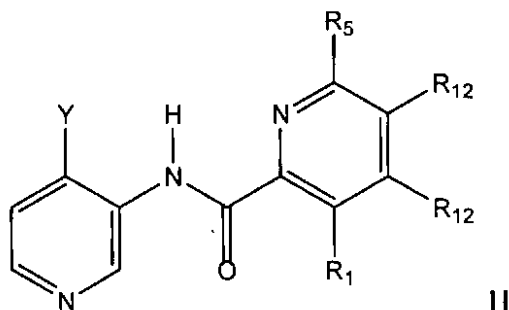
CARLOS R. OLARTE
CC. No. 79.782.747 de Bogotá
T.P. 74.295

Adjunto: Capítulo Reivindicatorio

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la fórmula II, o un estereoisómero, tautómero, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo:

5



II

10 en donde:

Y es ciclohexilo sustituido con uno a tres sustituyentes;

R₁ es hidrógeno, -NH₂, o halógeno;

15 R₁₂, independientemente en cada presentación, se selecciona a partir del grupo que consiste en hidrógeno y halógeno; y

R₅ se selecciona a partir de ciclohexilo, fenilo, y piridilo, en donde este ciclohexilo, este fenilo, y este piridilo están cada uno independientemente sustituidos con hasta tres sustituyentes seleccionados a partir de halógeno, hidroxilo, 20 alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y O-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono.

2. Un compuesto de la reivindicación 1, en donde Y está sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados a partir de hidroxilo, amino, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, 25 y halo-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono.

3. Un compuesto de la reivindicación 2, en donde Y está sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados a partir de metilo, hidroxilo, amino, y CF_3 .

4. Un compuesto de la reivindicación 2, en donde R_1 es hidrógeno, amino, o flúor.

5. Un compuesto de la reivindicación 2, en donde R_5 es piridilo o fenilo.

6. Un compuesto de la reivindicación 5, en donde R_5 es fenilo sustituido con hasta tres sustituyentes seleccionados a partir de halógeno, hidroxilo, alcóxilo, y alquilo de 1 a 4 átomos de carbono.

7. Un compuesto de la reivindicación 5, en donde Y está sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados a partir de metilo, hidroxilo, amino, y CF_3 ; R_1 es hidrógeno; y R_5 es fenilo sustituido con hasta tres sustituyentes seleccionados a partir de flúor, hidroxilo, metilo, etilo, metóxilo, y propóxilo.

8. Un compuesto de la reivindicación 7, en donde R_1 es 2,6-difluoro-fenilo.

9. Un compuesto de la reivindicación 1, seleccionado a partir del grupo que consiste en:

N-(4-((3S,5S)-3-amino-5-metil-ciclohexil)-piridin-3-il)-6-(2,6-difluoro-fenil)-5-fluoro-picolinamida;

3-amino-N-(4-((1R,3R,4S,5S)-3-amino-4-hidroxi-5-metil-ciclohexil)-piridin-3-il)-6-(2,6-difluoro-fenil)-picolinamida;

N-(4-((3R,4R,5S)-3-amino-4-hidroxi-5-metil-piperidin-1-il)-

piridin-3-il)-6-(2,6-difluoro-fenil)-5-fluoro-picolinamida;

3-amino-N-(4-((1R,3S)-3-amino-ciclohexil)-piridin-3-il)-6-(2,6-difluoro-fenil)-5-fluoro-picolinamida; y

N-(4-((3S)-3-amino-ciclohexil)-piridin-3-il)-6-(2,6-difluoro-fenil)-5-fluoro-picolinamida, o un estereoisómero, tautómero, o una sal farmacéuticamente aceptable de las mismas.

10. Una composición farmacéutica, la cual comprende un compuesto de cualquiera de la reivindicación 1 a la reivindicación 9.

10 11. Una composición farmacéutica, la cual comprende un compuesto de cualquiera de la reivindicación 1 a la reivindicación 9, en donde esta composición farmacéutica comprende un agente adicional para el tratamiento de cáncer.

12. Una composición farmacéutica de la reivindicación 15 11, en donde el agente adicional se selecciona a partir de irinotecano, topotecano, gemcitabina, 5-fluoro-uracilo, leucovorina, carboplatina, cisplatina, taxanos, tezacitabina, ciclofosfamida, alcaloides vinca, imatinib (Gleevec), antraciclina, rituximab, y trastuzumab.

20 13. Un uso de un compuesto de cualquiera de la reivindicación 1 a la reivindicación 9, para la preparación de un medicamento para el tratamiento de una condición mediante la modulación de la integración de la actividad del provirus de la cinasa Maloney (Cinasa PIM).

25 14. El uso de la reivindicación 13, en donde la condición

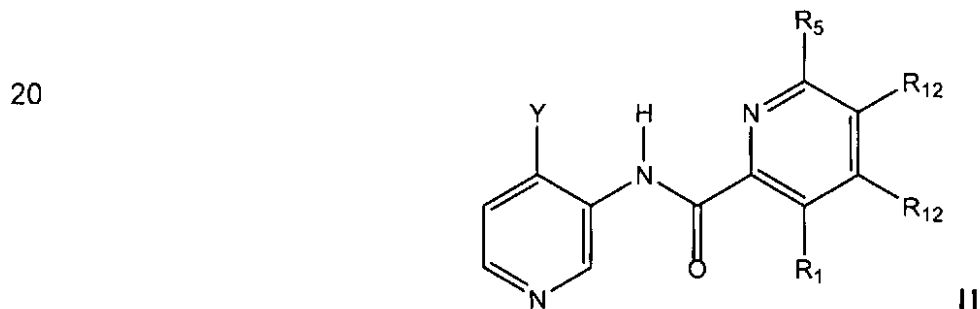
es un cáncer seleccionado a partir de carcinoma de los pulmones, páncreas, tiroides, ovarios, vejiga, mama, próstata, o colon, melanoma, leucemia mieloide, mieloma múltiple, y eritroleucemia, adenoma de colon vellosa, y osteosarcoma.

5 15. Un compuesto de las reivindicaciones 1 a 9, para utilizarse en el tratamiento de una condición mediante la modulación de la integración de la actividad del provirus de la cinasa Maloney (Cinasa PIM).

10 16. El compuesto de la reivindicación 15, en donde la condición es un cáncer seleccionado a partir de carcinoma de los pulmones, páncreas, tiroides, ovarios, vejiga, mama, próstata, o colon, melanoma, leucemia mieloide, mieloma múltiple, y eritroleucemia, adenoma de colon vellosa, y osteosarcoma.

15 17. Un compuesto de la fórmula II, seleccionado a partir del Cuadro I o del Cuadro II.

 18. Un compuesto de la fórmula II, o un estereoisómero, tautómero, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo:



en donde:

25 Y es piperidinilo sustituido con metilo, hidroxilo, y amino;

R_1 se selecciona a partir del grupo que consiste en hidrógeno, NH_2 , y flúor;

R_{12} , independientemente en cada presentación, se selecciona a partir del grupo que consiste en hidrógeno y
5 halógeno; y

R_5 se selecciona a partir de piridilo, fluoro-piridilo, ciclohexilo, y fenilo, en donde el fenilo está sustituido con hasta tres sustituyentes seleccionados a partir de flúor, hidroxilo, y metilo.

10 19. Un compuesto de la reivindicación 18, en donde Y representa 3-amino-4-hidroxi-5-metil-piperidin-1-ilo.

20. Un compuesto de la reivindicación 18 ó 19, en donde R_1 es hidrógeno.

15 21. Un compuesto de la reivindicación 20, en donde R_5 es difluoro-fenilo.

22. Un compuesto de la reivindicación 18 o de la reivindicación 19, en donde R_5 es 2,6-difluoro-fenilo.

23. Un compuesto de la reivindicación 18, seleccionado a partir de N-(4-((3R,4R,5S)-3-amino-4-hidroxi-5-metil-piperidin-1-il)-piridin-3-il)-6-(2,6-difluoro-fenil)-5-fluoro-
20 picolinamida, 3-amino-N-(4-((3R,4R,5S)-3-amino-4-hidroxi-5-metil-piperidin-1-il)-piridin-3-il)-6-(2,6-difluoro-fenil)-5-fluoro-picolinamida, y N-(4-((3R,4R,5S)-3-amino-4-hidroxi-5-metil-piperidin-1-il)-piridin-3-il)-6-(2,6-difluoro-3-metil-fenil)-5-fluoro-
25 picolinamida.

24. Una composición farmacéutica, la cual comprende un compuesto de la reivindicación 18 o de la reivindicación 23, en donde esta composición farmacéutica comprende cuando menos un agente adicional para el tratamiento de cáncer.

5 25. La composición farmacéutica de la reivindicación 24, en donde el agente adicional se selecciona a partir del grupo que consiste en irinotecano, topotecano, gemcitabina, 5-fluorouracilo, leucovorina, carboplatina, cisplatina, taxanos, tezacitabina, ciclofosfamida, alcaloides vinca, imatinib
10 (Gleevec), antraciclinas, rituximab, y trastuzumab.

26. Un uso de un compuesto de la reivindicación 18, para la preparación de un medicamento para el tratamiento de una condición mediante la modulación de la integración de la actividad del provirus de la cinasa Maloney (Cinasa PIM).

15 27. El uso de la reivindicación 26, en donde la condición es un cáncer seleccionado a partir de carcinoma de los pulmones, páncreas, tiroides, ovarios, vejiga, mama, próstata, o colon, melanoma, leucemia mieloide, mieloma múltiple, y eritroleucemia, adenoma de colon vellosa, y osteosarcoma.

20 28. Un compuesto de las reivindicaciones 18 a 23, para utilizarse en el tratamiento de una condición mediante la modulación de la integración de la actividad del provirus de la cinasa Maloney (Cinasa PIM).

25 29. El compuesto de la reivindicación 28, en donde la condición es un cáncer seleccionado a partir de carcinoma de

los pulmones, páncreas, tiroides, ovarios, vejiga, mama, próstata, o colon, melanoma, leucemia mieloide, mieloma múltiple, y eritroleucemia, adenoma de colon vellosa, y osteosarcoma.

- 5 28. Un compuesto de la fórmula II, seleccionado a partir del Cuadro I o del Cuadro II.

10

15

20

25