

**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  
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. \_\_\_\_\_ S. \_\_\_\_\_ D. \_\_\_\_\_

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-087033- -00001-0000

Fecha: 2011-07-18 16:57:19 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI  
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 9

Re: PI.-JANSSEN PHARMACEUTICA NV.-Solicitud de Patente de  
Invención en Fase Nacional PCT para "DERIVADOS DE INDOL  
COMO AGENTES ANTICÁNCER".-Clase C07D 401/12.-Expediente  
número 11-087.033.-

1. Me refiero a la Resolución No. **69699** por medio de la cual se establece el pago de una tasa por cada reivindicación adicional, que exceda las primeras 10 reivindicaciones.

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 12, 14 y 15, las cuales fueron reenumeradas como 11, 12 y 13 respectivamente. En consecuencia, este juego de reivindicaciones deberá ser estudiado junto con la presente solicitud.

3. Anexo me permito presentar:

- (a) Recibos número 11-0059625, 11-0059626 y 11-0059627 que acreditan el pago de la tasa mencionada; y
- (b) Copia del capítulo reivindicatorio que debe tenerse en cuenta para estudio compuesto por **13** 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 - 0059625

Bogotá D.C., Junio 20 de 2011 - 18:02:31

RECIBIDO DE : LLOREDA & CIA S.A. NI 8.300.221.455

\*\*\* Soporte del Pago \*\*\*

| TIPO PAGO    | BANCO           | CUENTA    | No. PAGO  | FECHA PAGO | VR PAGO       |
|--------------|-----------------|-----------|-----------|------------|---------------|
| RECIBO DE CA | BANCO DE BOGOTA | 062754387 | 414999863 | 20/06/2011 | 22.448.000.00 |

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

| CANT. | RENTISTICO              | CONCEPTO                                                  | Vr.UNDITARIO | Vr.CONCEPTO |
|-------|-------------------------|-----------------------------------------------------------|--------------|-------------|
| 1     | 50005-01-01 SOLICITUDES | 1607 REIVINDICACION UNITARIA ADICIONAL A LAS 10 INICIALES | 27.000.00    | 27.000.00   |
|       |                         |                                                           |              | \$27.000.00 |

SON: \*\*VEINTISIETE MIL PESOS MONEDA CORRIENTE\*\*

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

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

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-087033- -00001-0000

Fecha: 2011-07-18 16:57:19 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI  
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 9

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

Web: [www.sic.gov.co](http://www.sic.gov.co) e-mail: [info@sic.gov.co](mailto:info@sic.gov.co) Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Línea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

, Junio 20 de 2011 - 18:02:44

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



RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0059626

Bogotá D.C., Junio 20 de 2011 - 18:02:31

RECIBIDO DE : LLOREDA & CIA S.A. NI 8.300.221.455

\*\*\* Soporte del Pago \*\*\*

| TIPO PAGO    | BANCO           | CUENTA    | No. PAGO  | FECHA PAGO | VR. PAGO      |
|--------------|-----------------|-----------|-----------|------------|---------------|
| RECIBO DE CA | BANCO DE BOGOTA | 062754387 | 414999863 | 20/06/2011 | 22.448.000.00 |

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

| CANT. | RENTISTICO              | CONCEPTO                                                     | Vr.UNDITARIO | Vr.CONCEPTO |
|-------|-------------------------|--------------------------------------------------------------|--------------|-------------|
| 1     | 50005-01-01 SOLICITUDES | 1607 REIVINDICACION UNITARIA ADICIONAL<br>A LAS 10 INICIALES | 27.000.00    | 27.000.00   |
|       |                         |                                                              |              | \$27.000.00 |

SON: \*\*VEINTISIETE MIL PESOS MONEDA CORRIENTE\*\*\*

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

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

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-087033- -00001-0000

Fecha: 2011-07-18 16:57:19 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI  
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 9

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

, Junio 20 de 2011 - 18:02:44

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



RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0059627

Bogotá D.C., Junio 20 de 2011 - 18:02:31

RECIBIDO DE : LLOREDA & CIA S.A. NI 8.300.221.455

\*\*\* Soporte del Pago \*\*\*

| TIPO PAGO    | BANCO           | CUENTA    | No. PAGO  | FECHA PAGO | VR. PAGO      |
|--------------|-----------------|-----------|-----------|------------|---------------|
| RECIBO DE CA | BANCO DE BOGOTA | 062754387 | 414999863 | 20/06/2011 | 22.448.000.00 |

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

| CANT. RENTISTICO          | CONCEPTO                                                     | Vr. UNIDITARIO | Vr. CONCEPTO |
|---------------------------|--------------------------------------------------------------|----------------|--------------|
| 1 50005-01-01 SOLICITUDES | 1607 REIVINDICACION UNITARIA ADICIONAL<br>A LAS 10 INICIALES | 27.000.00      | 27.000.00    |
|                           |                                                              |                | \$27.000.00  |

SON: \*\*VEINTISIETE MIL PESOS MONEDA CORRIENTE\*\*\*

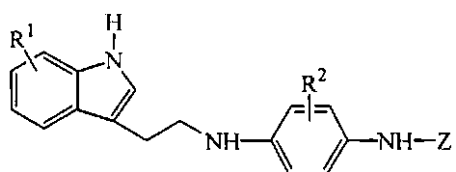
Responsable: \_\_\_\_\_

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

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO  
No. 11-087033- -00001-0000  
Fecha: 2011-07-18 16:57:19 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI  
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 9

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la fórmula (I)



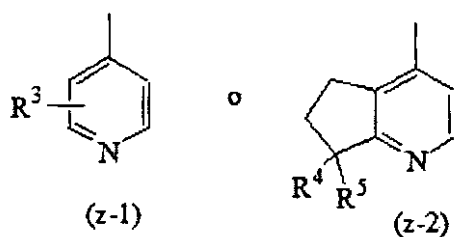
5

(I)

incluyendo cualquiera de sus formas estereoquímicamente isoméricas, en donde  
 R¹ es hidroxialquilo C<sub>1-6</sub> o alquenilo C<sub>2-6</sub>; siempre que el sustituyente R¹ esté  
 ubicado en la posición 6 ó 7 del resto indol;

R² es hidrógeno o alquilo C<sub>1-4</sub>;

10 Z es un radical seleccionado de



R³ es hidrógeno o hidroxialquilo C<sub>1-4</sub>;

R⁴ es hidroxí o alquilo C<sub>1-4</sub>;

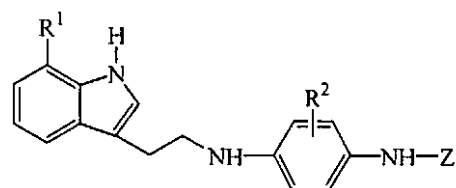
R⁵ es hidrógeno o alquilo C<sub>1-4</sub>; o

15 R⁴ y R⁵ se toman juntos para tomar oxo;

una de sus sales farmacéuticamente aceptables o uno de sus solvatos.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde el compuesto tiene  
 la siguiente fórmula:

20



(I-a)

5

3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2, en donde  $R^1$  es hidroxialquilo  $C_{1-6}$ .

4. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en donde  $R^2$  es alquilo  $C_{1-4}$ .

10

5. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en donde Z es un radical de la fórmula (z-1).

6. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en donde Z es un radical de la fórmula (z-2).

15

7. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 6, en donde  $R^4$  es hidroxilo y  $R^5$  es hidrógeno.

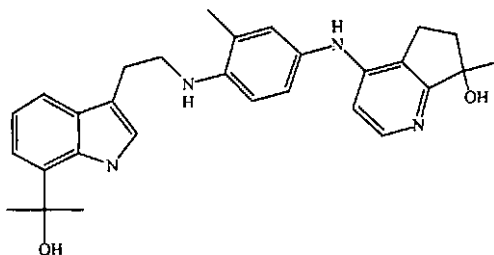
20

8. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 6, en donde  $R^4$  es hidroxilo y  $R^5$  es alquilo  $C_{1-4}$ .

9. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde el compuesto es un enantiómero que tiene la fórmula:

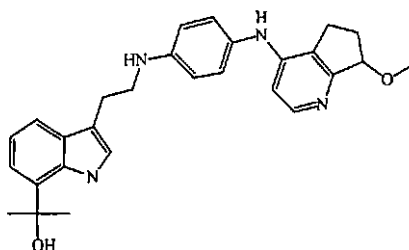
25

127



y que tiene una rotación levorrotatoria medida con luz a la longitud de onda de la línea D de sodio (589 nm) a una temperatura de 20 °C y una longitud de paso celular de 1 dm en cloroformo en una concentración de 8,59 mg/ml; o una de sus sales farmacéuticamente aceptables o uno de sus solvatos.

10. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde el compuesto es un enantiómero que tiene la fórmula:



10

y que tiene una rotación dextrorrotatoria medida con luz a la longitud de onda de la línea D de sodio (589 nm) a una temperatura de 20 °C y una longitud de paso celular de 1 dm en metanol en una concentración de 10,33 mg/ml; o una de sus sales farmacéuticamente aceptables o uno de sus solvatos.

15

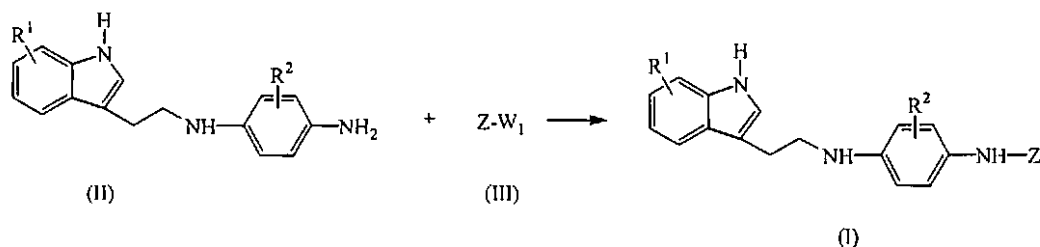
11. Una composición farmacéutica que comprende un portador farmacéuticamente aceptable y como un ingrediente activo una cantidad terapéuticamente efectiva de un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10.

20

12. Una combinación de uno o varios agentes anticáncer y un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10.

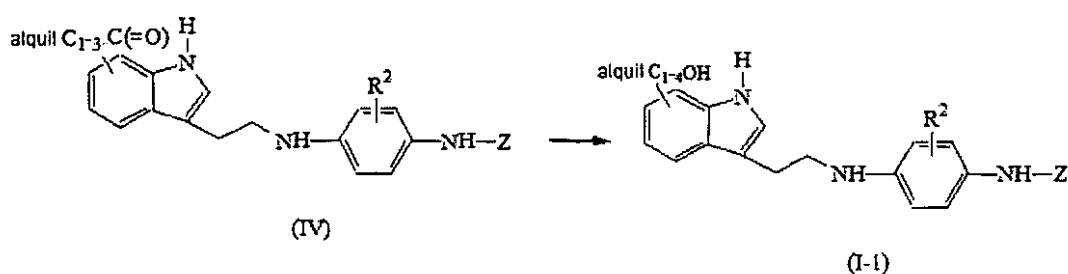
13. Un proceso para preparar un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque:

a) se hace reaccionar un intermediario de la fórmula (II) con un intermediario de la fórmula (III), en donde  $W_1$  es un grupo saliente apropiado, en un solvente inerte a la reacción opcionalmente en presencia de una base apropiada o se hace reaccionar un intermediario de la fórmula (II) con un intermediario de la fórmula (III), en donde  $W_1$  es un grupo saliente apropiado en presencia de un catalizador apropiado, un ligando apropiado, una base apropiada y un solvente apropiado



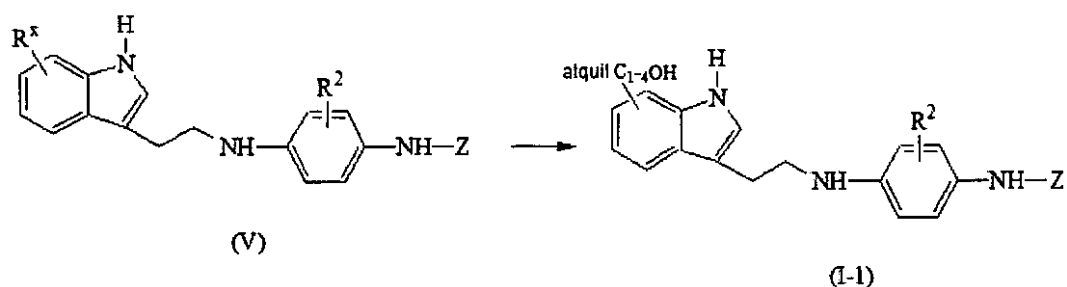
con  $R^1$ ,  $R^2$  y  $Z$  tal como se definen en la reivindicación 1;

b) se hace reducir el correspondiente derivado carbonilo de la fórmula (IV) en presencia de un agente de reducción apropiado y un solvente apropiado,



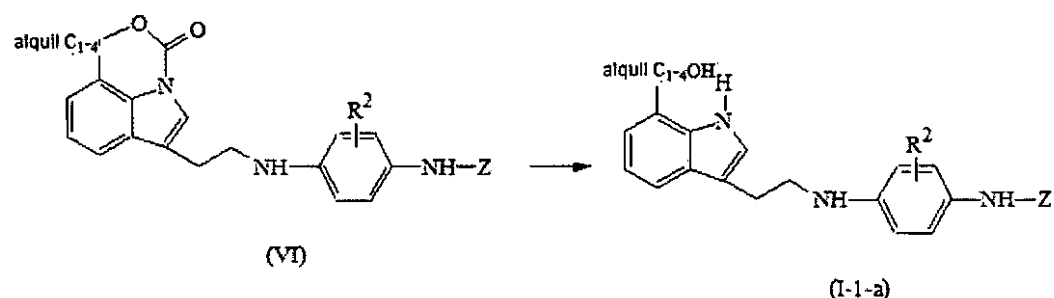
con  $R^2$  y  $Z$  tal como se definen en la reivindicación 1;

c) se hace reducir el correspondiente derivado de éster de la fórmula (V), en donde  $R^x$  representa -alquil  $C_{1-3}C(=O)O$ alquilo  $C_{1-4}$ , en presencia de un agente de reducción apropiado y un solvente apropiado,



5 con  $R^2$  y Z tal como se definen en la reivindicación 1;

d) se hidroliza un intermediario de la fórmula (VI) con una base apropiada en presencia de un solvente apropiado,



10 con  $R^2$  y Z tal como se definen en la reivindicación 1;

o, si se desea, se convierten compuestos de la fórmula (I) en cada uno de los otros de acuerdo con las transformaciones conocidas en la técnica y también, si se desea, se convierten los compuestos de la fórmula (I) en una sal por adición de ácidos no tóxica terapéuticamente activa por tratamiento con un ácido o en una sal por adición de bases no tóxica terapéuticamente activa por tratamiento con una base o, por el contrario, se convierte la forma de sal por adición de ácidos en la base libre por tratamiento con álcali o se convierte la sal por adición de bases en el ácido libre por tratamiento con ácido; o, si se desea, se preparan formas estereoquímicamente isoméricas o sus solvatos.