

OLARTE RAISBECK


Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

142-03/1681
119
SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicación: 04002410 00000003 Folios: 10
Fecha (AMD): 2004-12-15 05:44:07
Trámite: 011 PCT PATENT 379 FASE HACI 329 COMPLEMEN
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

SOLICITUD DE:

- 1 ☐ Corrección de Error Material. ☒ Modificación a una Solicitud.

2
S LICITANTE
(71)

Nombre: GLAXO GROUP LIMITED.

Dirección: Glaxo Wellcome House, Berkeley Avenue, Greenford, Middlesex UB6 ONN GB.
Nacionalidad o Domicilio: BRITANICA
Lugar de Constitución: INGLATERRA.

Teléfono: _____ Fax: _____
E-mail: _____

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐ NIT ☐
C.E. ☐ Otro ☐
Cual _____

Número _____

3
REPRESENTANTE
APODERADO

Nombre: CARLOS R. OLARTE

Dirección: World Trade Center Torre A
Calle 100 No. 8ª-37 Piso 10, Bogotá
Teléfono: 601-7700 Fax: 601-7799
E-mail: _____

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒ NIT ☐
C.E. ☐ Otro ☐
Cual _____

Número 79.782.747Bta
TP 74.295

4
Número de expediente:
04.002.410

5
Descripción de la corrección o modificación solicitada Me permito **MODIFICAR** la **REIVINDICACION 12** en la cual se había omitido el esquema de síntesis y su descripción correspondiente por error. Lo anterior se encuentra plenamente sustentado en el Capítulo Descriptivo, páginas 16 a 18, por lo tanto le aclaro al Despacho que no se añadió materia nueva.

6
Comprobante de pago No. 93,917 Fecha Diciembre 3, 2004

7
Anexos

- ☒ Comprobante de pago de la tasa.
☐ Poderes, si fuere el caso.
☐ 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

+20 -2
120

NIT : 000174089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 04 - 93,917
FECHA : DICIEMBRE 3 DE 2004

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radication : 84882416 60888883 Folios: 10
Fecha (HND): 2004-12-15 09:44:07
Tramite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NNCI 329 COMPLEMEN
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

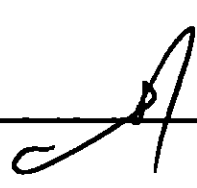
***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
JOSE SANTOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	030-00110-6	33693624	02/12/2004	5,212,000.

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LEYAS COMERCIALES	87,000.00
		TOTAL :	87,000.

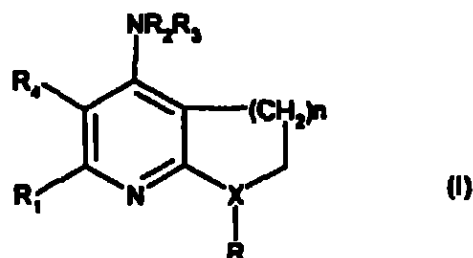
SOM: OCHENTA Y SIETE MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

CAPITULO REIVINDICATORIO MODIFICAD

1.- Los compuestos de la fórmula (I) incluyendo, estereoisómeros, profármacos y sales y solvatos de los mismos farmacéuticamente aceptables

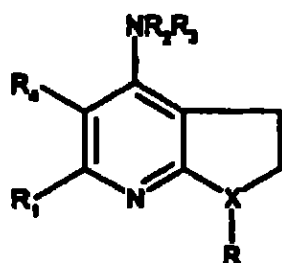


en donde R es arilo o heteroarilo, cada uno de los cuales puede estar sustituido por 1 a 4 grupos seleccionados a partir de: halógeno, alquilo de C1-C6, alcoxi de C1-C6, haloalquilo de C1-C6, alquenilo de C2-C6, alquinilo de C2-C6, haloalcoxi de C1-C6, -C(O)R₅, nitro, -NR₆R₇, ciano, y un grupo R₈; R₁ es un hidrógeno, alquilo de C1-C6, alquenilo de C2-C6, alquinilo de C2-C6, haloalquilo de C1-C6, haloalcoxi de C1-C6, halógeno, NR₆R₇ o ciano; R₂ es hidrógeno, cicloalquilo de C3-C7, o un grupo R₉; R₃ es cicloalquilo de C3-C7; o un grupo R₉; o R₂ y R₃ junto con N forman un heterociclo de 5-14 miembros, el cual puede estar sustituido por 1 a 3 grupos R₁₀; R₄ es hidrógeno, alquilo de C1-C6, halógeno o haloalquilo de C1-C6; R₅ es alquilo de C1-C4, -OR₈ o -NR₆R₇; R₆ es hidrógeno o alquilo de C1-C6; R₇ es hidrógeno o alquilo de C1-C6; R₈ es un heterociclo de 5-6 miembros, el cual puede estar saturado o puede contener uno a tres enlaces dobles, y el cual puede estar sustituido por 1 o más grupos R₁₁; R₉ es un alquilo de C1-C6 que puede estar sustituido por uno o más grupos seleccionados a partir de: cicloalquilo de C3-C7, alcoxi de C1-C6, haloalcoxi de C1-C6, hidroxilo, haloalquilo de C1-C6; R₁₀ es un grupo R₈, cicloalquilo de C3-C7, alquilo de C1-C6, alcoxi de C1-C6, haloalquilo de C1-C6, alquenilo de C2-C6, alquinilo de C2-C6, haloalcoxi de C1-C6, hidroxilo, halógeno, nitro, ciano, C(O)NR₆R₇, fenilo el cual puede estar sustituido por 1 a 4 grupos R₁₁; R₁₁ es cicloalquilo de C3-C7, alquilo de C1-C6, alcoxi de C1-

C6, haloalquilo de C1-C6, alquenilo de C2-C6, alquinilo de C2-C6, haloalcoxi de C1-C6, hidroxilo, halógeno, nitrógeno, ciano o $C(O)NR_6R_7$; X es carbono o nitrógeno; n es 0 ó 1.

2.- Los compuestos de conformidad con la reivindicación 1, caracterizados además porque R_2 y R_3 junto con N forman un grupo heterociclo de 5-14 miembros, el cual puede estar sustituido por 1 a 3 grupos R_{10} .

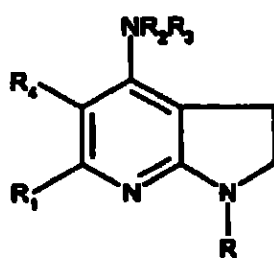
3.- Los compuestos de conformidad con la reivindicación 1, caracterizados además porque tienen la fórmula general (Ia)



(Ia)

en la que R, R_1 , R_2 , R_3 , R_4 y X son como se definen en la reivindicación 1.

4.- Los compuestos de conformidad con la reivindicación 3, caracterizados además porque tienen la fórmula general (IIa)

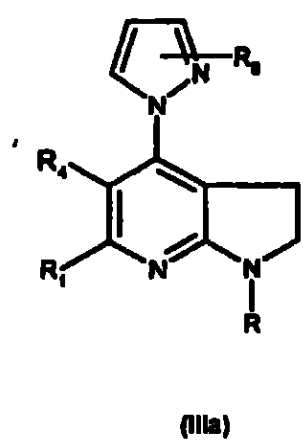


(IIa)

en la que R, R_1 , R_2 , R_4 y R_3 son como se definen en la reivindicación 1.

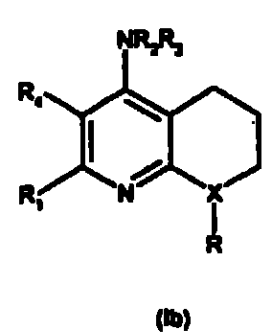
5.- Los compuestos de conformidad con la reivindicación 4, caracterizados además porque el grupo NR_2R_3 representa un grupo heterociclo de 5-6 miembros, el cual puede estar sustituido por 1 a 3 grupos R_4 .

6.- Los compuestos de conformidad con la reivindicación 5, caracterizados además porque tienen la fórmula general (IIIa)



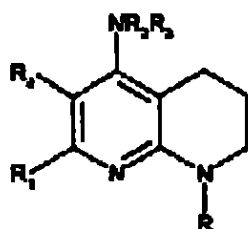
en la que R, R_1 , R_4 y R_3 son como se definen en la reivindicación 1.

7.- Los compuestos de conformidad con la reivindicación 1, caracterizados además porque tienen la fórmula general (Ib)



en la que R, R_1 , R_2 , R_3 , R_4 y X son como se definen en la reivindicación 1.

8.- Los compuestos de conformidad con la reivindicación 7, caracterizados además porque tienen la fórmula general (IIb)



(IIb)

en la que R, R₁, R₂, R₄ y R₃ son como se defienden en la reivindicación 1.

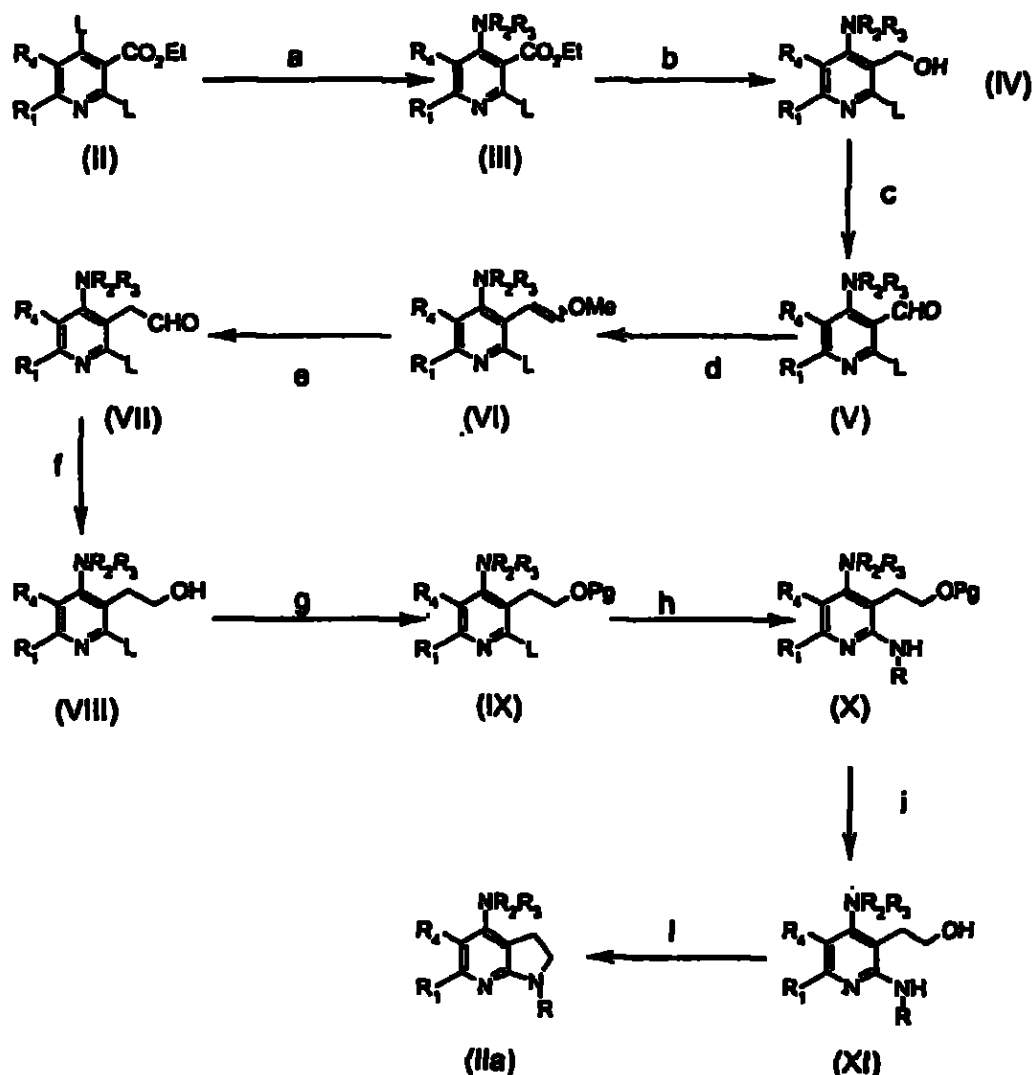
9.- Los compuestos de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, caracterizados además porque R₁ es un grupo alquilo de C1-C3 o un grupo haloalquilo de C1-C3 y R₄ es hidrógeno.

10.- Los compuestos de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, caracterizados además porque R es un grupo arilo seleccionado a partir de: 2,4-diclorofenilo, 2-cloro-4-metilfenilo, 2 cloro-4-trifluorometilo, 2-cloro-4-metoxifenilo, 2,4,5-trimetilfenilo, 2,4 dimetilfenilo, 2-metil-4-metoxifenilo, 2-metil-4-clorofenilo, 2-metil-4-trifluorometilo, 2,4-dimetoxifenilo, 2-metoxi-4-trifluorometilfenilo, 2 metoxi-4-clorofenilo, 3-metoxi-4-clorofenilo, 2,5-dimetoxi-4-clorofenilo, 2-metoxi-4-isopropilfenilo, 2-metoxi-4-trifluorometilfenilo, 2-metoxi-4-isopropilfenilo, 2-metoxi-4-metilfenilo, 2-trifluorometil-4-clorofenilo, 2,4-trifluorometilfenilo, 2-trifluorometil-4-metilfenilo, 2-trifluorometil-4-metoxifenilo, 2-bromo-4-isopropilfenilo, 2-metil-4-cianofenilo, 2-cloro-4-cianofenilo, 4-metil-6-dimetilaminopiridin-3-ilo, 3,5-dicloro-piridin-2-ilo, 2,6-bismetoxi-piridin-3-ilo y 3-cloro-5-triclorometil-piridin-2-ilo.

11.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, caracterizado además porque se selecciona a partir del grupo que consiste de: 1- (2, 4-bis-trifluorometil-fenil)-6-metil-4- (3-tiazol-2-il-pirazol-1-il)-2, 3-dihidro-1H- pirrolo [2,3-b] piridina; 1- (2, 4-bis-trifluorometil-fenil)-6-metil-4- (3-tiazol-2-il-pirazol-1-il)-2, 3-dihidro-1H- pirrolo [2,3-b] piridina; 3-metil-

4- [6-metil-4- (3-tiazol-2-il-pirazol-1-il)-2,3-dihidro-1H-pirrolo [2,3-b] piridin-1-il] - benzonitrilo; 4- [6-metil-4- (3-tiazol-2-il-pirazol-1-il)-2, 3-dihidro-1H-pirrolo [2,3-b] piridin-1-il]-3- trifluorometil-benzonitrilo; 6-metil-1- (2-metil-4-trifluorometoxi-fenil)-4- (3-tiazol-2-il-pirazol-1-il)-2,3- dihidro-1H-pirrolo [2,3-b] piridina; 1- (2, 4-bis-trifluorometil-fenil)-7-metil-5- (3-tiazol-2-il-pirazol-1-il)-1,2,3, 4- tetrahidro- [1,8] naftiridina; 1- (4-metoxi-2-metil-fenil)-6-metil-4- (3-tiazol-2-il-pirazol-1-il)-2, 3-dihidro-1H- pirrolo [2,3-b] piridina; 1- (2, 4-bis-trifluorometil-fenil)-6-metil-4- (3-morfolin-4-il-pirazol-1-il)-2,3-dihidro-1H-pirrolo [2,3-b] piridina; 1- (2, 4-bis-trifluorometil-fenil)-6-metil-4- (3-piridin-2-il-pirazol-1-il)-2, 3-dihidro-1H-pirrolo [2,3-b] piridina; 4- [1,3'] bipirazolil-1'-il-1-(2, 4-bis-trifluorometil-fenil)-6-metil-2,3-dihidro-1H-pirrolo [2, 3-b] piridina.

12.- El procedimiento para la preparación de un compuesto de la fórmula (IIa) de conformidad con la reivindicación 4, de acuerdo con el siguiente esquema:



en el cual

- el paso a representa la conversión del grupo residual L, seleccionado en un grupo que consiste de: halógeno o residuo reactivo del ácido sulfónico (por ejemplo mesilato, tosilato), preferiblemente cloruro, en el grupo amino de los compuestos (III), mediante la reacción con la amina adecuada NR_2R_3 en condiciones básicas;
- el paso b representa la reducción del grupo éster con un agente reductor adecuado (tal como DIBAL-H) a los grupos hidroxí de los compuestos (IV);
- el paso c representa la oxidación del grupo hidroxí con un agente oxidante adecuado (tal como periodinano de Dess-Martin) a un grupo aldehído del compuesto (V);
- el paso d representa la formación del grupo aldehído de los compuestos (VII) mediante reacción de Wittig en las condiciones usuales, a través de la formación del éter de enol seguido por hidrólisis ácida (paso e);
- el paso f representa la reducción del grupo aldehído con un agente reductor adecuado (tal como NaBH_4) al grupo hidroxí de los compuestos (VIII);
- el paso g representa la conversión del grupo hidroxí en el grupo protector adecuado de los compuestos (IX) (tal como TBS: tert-butildimetilsililo);
- el paso h representa la reacción de Buchwald mediante acoplamiento con la amina adecuada RNH_2 ;
- el paso i representa la reacción de desprotección para dar el grupo hidroxí de los compuestos (XI);
- el paso l representa la formación del ciclo intramolecular mediante calentamiento después de la conversión del

grupo hidroxil de los compuestos (XI) es un grupo residual adecuado (tal como bromuro, mediante la reacción con CBr_4 y PPh_3) para dar los compuestos finales (IIa).

13.- El uso de un compuesto como el que se reclama en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11, en la preparación de un medicamento para uso en el tratamiento de condiciones mediadas por CRF (factor liberador de corticotropina).

14.- El uso de un compuesto como el que se reclama en la reivindicación 13, en la preparación de un medicamento para uso en el tratamiento de la depresión y la ansiedad.

15.- El uso de un compuesto como el que se reclama en la reivindicación 14, en la preparación de un medicamento para uso en el tratamiento de IBS (enfermedad de intestino irritable) e IBD (enfermedad de intestino inflamatorio).

16.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11, caracterizado además porque se utiliza en el tratamiento de condiciones mediadas por CRF (factor liberador de corticotropina).

17.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 16, caracterizado además porque se utiliza en el tratamiento de depresión y de ansiedad.

18.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 17, caracterizado además porque se utiliza en el tratamiento de IBS (enfermedad de intestino irritable) e IBD (enfermedad de intestino inflamatorio).

19.- Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11, caracterizada además porque comprende una mezcla con uno o más vehículos o excipientes fisiológicamente aceptables.

20.- Un método para el tratamiento de un mamífero, incluyendo el hombre, en particular para el tratamiento de condiciones mediadas por CRF (factor liberador de corticotropina), que comprende la administración de una cantidad efectiva de un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11.

21.- El método de conformidad con la reivindicación 20, caracterizado además porque se utiliza en el tratamiento de depresión y ansiedad, que comprende la administración de una cantidad efectiva de un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11.

22.- El método de conformidad con la reivindicación 21, caracterizado además porque se utiliza en el tratamiento de IBS (enfermedad de intestino irritable) e IBD (enfermedad de intestino inflamatorio), que comprende la administración de una cantidad efectiva de un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11.

2020
Bogotá D C

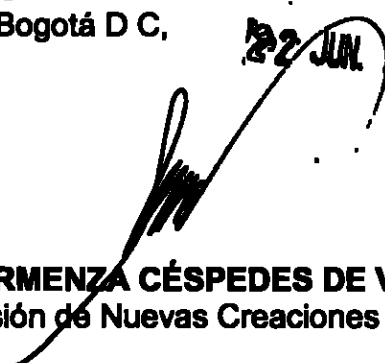
Doctor(a)
CARLOS R. OLARTE.
Apoderado(a)

REFERENCIA:	Radicación N°	04-02410
	Solicitud internacional	PCT/EP02/07865
	Fecha límite fase nacional	17/02/2004
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	416
	Oficio N°	442
	Folios	001

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en los artículos 26 y 27 de la Decisión 486, de la Comisión de la Comunidad Andina, y en las demás disposiciones vigentes sobre la materia, se envía el extracto de la solicitud a la oficina de comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial, conforme lo establece el artículo 40 de la Decisión 486.

Cúmplase
Dado en Bogotá D C,

22 JUN 2005


ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe División de Nuevas Creaciones

202051