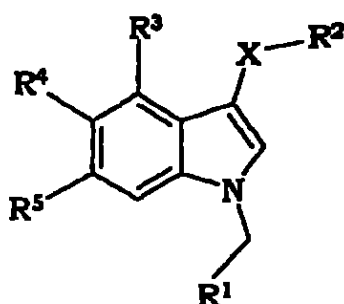


**FORMULARIO UNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES
2000-10**

1 SOLICITUD DE: ☐ Corrección de Error Material ☒ Modificación a una solicitud		
2 SOLICITANTE	Nombre: AKZO NOBEL N.V. sociedad constituida y existente bajo las leyes de. Holanda Dirección: Velperweg 76, 6824 RM arnhem, Holanda Teléfono: 548 09 70 E-mail: clientes@camyp.com Fax: 249 40 70 Domicilio: Arnhem Holanda	IDENTIFICACION C.C. ☐ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Número: _____
3 REPRESENTANTE APODERADO	Nombre: Emilio FERRERO Dirección: Carrera 4ª No. 72-35 Teléfono: 347 36 11 E-mail: cavelier@cavelier.com Fax: 217 92 11 Domicilio: Bogotá, Colombia	IDENTIFICACION C.C. ☒ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Número: 438.019 TP 31.929
4 Número de expediente: 05.053.827 Clase: C07D 209/030 Título del invento: INDOLES UTILES EN EL TRATAMIENTO DE ENFERMEDADES RELACIONADAS CON ANDROGENOS RECEPTORES.		
5 Descripción de la corrección o modificación solicitada: Presento nuevo capítulo reivindicatorio compuesto por 18 reivindicaciones. Por lo tanto, solicito que se realice el examen de patentabilidad sobre este nuevo capítulo reivindicatorio.		
6 Comprobante de pago No. 06- 38,492 Fecha: 22 de Mayo de 2006		
7 Anexos: ☒ Comprobante de pago de la tasa por \$ 95.000 ☐ Poderes, si fuere el caso ☐ Certificado de existencia y representación legal, cuando el solicitante sea persona jurídica		
8 NOMBRE: EMILIO FERRERO FIRMA:  C.C. 438.019 de Usaquén T.P.A. 31.929		

REVINDICACIONES

1. Un compuesto que tiene la formula



Donde

X es S, SO o SO₂

R¹ es una estructura anular no saturada o saturada, monociclica, hetero u homociclica, de 5- o 6- miembros opcionalmente sustituida con uno o mas sustituyentes seleccionados de los grupos de halógenos, CN, (1C-4C)fluoroalkil, nitro, (1C-4C)alkil, (1C-4C)alkoxi o (1C-4C)fluoroalkoxi.

R² es 2-nitrofenil, 2-cianofenil, 2-hidroximetil-fenil, piridina-2-il, piridina-2-il-N-oxido, 2-benzamida, metil ester del ácido 2- benzoico o 2-metoxifenil;

R³ es H, halógeno o (1C-4C)alkil;

R⁴ es H, OH, (1C-4C)alkoxi o halógeno;

R⁵ es H, OH, (1C-4C)alkoxi; NH₂, CN, halógeno, (1C-4C)fluoroalkil, NO₂, hidroxil, (1C-4C)alkil, CO₂H, CO₂(1C-6C)alkil, o

R⁵ es NHR⁶, donde R⁶ es (1C-6C)acil opcionalmente sustituido con uno o mas halógenos, S(O)₂(1C-4C)alkil, o S(O)₂aril opcionalmente sustituido con (1C-4C)alkil o uno o más halógenos.

R⁵ es C(O)N(R⁸ o R⁹) donde R⁸ y R⁹ cada uno independientemente son H, (3C-6C)cicloalkil, o CH₂R¹⁰, donde R¹⁰ es H, (1C-5C)alkil, (1C-5C)alkenil, hidroxil, (1C-3C)alkil, (1C-4C)alkilester de carboxil, (1C-4C)alkil, (1C-3C)alkoxil, (1C-3C)alkil,

(mono o di(1C-4C)alkil)aminometil, (mono- o di(1C-4C)alkil)aminocarbonil, o un anillo no aromático o aromático, monocíclico, hetero u homocíclico, de 3-, 4-, 5- o 6- miembros o R⁸ y R⁹ forman conjuntamente con el N un anillo no saturado o saturado, heterocíclico de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con (1C-4C)alkil; o una sal o forma hidratada a partir de ellos.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado en que

R¹ es una estructura anular no saturada o saturada, monocíclica, hetero u homocíclica de 5-o 6-miembros, opcionalmente sustituida con uno o mas sustituyentes seleccionados del grupo de halógeno, CN, CF₃, nitro, metoxi, trifluorometoxi o metil;

R² es 2-nitrofenil, 2-cianofenil, 2-hidroximetil-fenil, piridina-2-il, piridina-2-il-N-oxido, 2-benzamida, 2- metil éster de ácido benzoico o 2-metoxifenil;

R³ es H, halogeno o (1C-2C)alkil;

R⁴ es H o F.

3. Un compuesto de acuerdo a la reivindicación 2, caracterizado en que:

R⁵ es H, OH, (1C-4C)alkoxi, CN, halógeno, (1C-4C)fluoroalkil, NO₂, hidroxi(1C-4C)alkil, CO₂(1C-6C)alkil, o

R⁵ es NHR⁶, donde R⁶ es (1C-6C)acil opcionalmente sustituido con uno o mas halógenos, S(O)₂(1C-4C)alkil o S(O)₂aril opcionalmente sustituido con (1C-4C)alkil o uno o mas halógenos, o

R⁵ es C(O)N(R⁸, R⁹), donde R⁸ y R⁹ cada uno independientemente son H, (3C-6C)cicloalkil, o CH₂R¹⁰, donde R¹⁰ es H, (1C-5C)alkil, (1C-5C)alkenil, hidroxi(1C-3C)alkil, (1C-4C)alkilester de carboxi(1C-4C)alkil, (1C-3C)alkoxi(1C-3C)alkil, (mono- o di(1C-4C)alkil)aminometil, (mono- o di(1C-4C)alkil)-aminocarbonil, o un anillo no aromático o aromático, monocíclico, hetero u homocíclico de 3-, 4-, 5- o 6- miembros, o R⁸ y R⁹ forman conjuntamente con el N un anillo no saturado o

171

saturado, heterocíclico de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con (1C-4C)alkil.

4. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 3, caracterizado en que

R^3 es H o halógeno;

R^5 es H, OH, (1C-4C)alkoxi, CN, F, Cl, CF_3 , NO_2 , hidroxi(1C-4C)alkil, CO_2 (1C-6C)alkil, o

R^5 es NHR^6 , donde R^6 es (1C-6C)acil opcionalmente sustituido con uno o mas halógenos o

R^5 es $C(O)N(R^8, R^9)$, donde R^8 y R^9 cada uno independientemente son H, (3C-6C)cicloalkil, o CH_2R^{10} , donde R^{10} es H, (1C-5C)alkil, (1C-5C)alkenil, hidroxi(1C-3C)alkil, (1C-2C)alkilester de carboxi(1C-4C)alkil, (1C-3C)alkoxi(1C-3C)alkil, (mono- o di(1C-4C)alkil)aminometil, (mono- o di(1C-4C)alkil)aminocarbonil, (3C-5C)cicloalkil, o un anillo heterocíclico de 5- miembros.

5. Un compuesto de acuerdo a la reivindicación 4, caracterizado en que

X es S o SO_2 ;

R^2 es 2-nitrofenil, 2-hidroximetil-fenil, 2-benzamida, 2-metoxifenil, 2-cianofenil o piridina-2-il;

R^3 es H o F;

R^5 es H, OH, (1C-2C)alkoxi, CN, F, Cl, CF_3 , NO_2 , hidroxi(1C-4C)alkil, CO_2 (1C-4C)alkil, o

R^5 es NHR^6 , donde R^6 formil, acetil, fluoroacetil, difluoroacetil o trifluoroacetil o

R^5 es $C(O)N(R^8, R^9)$, donde R^8 es H, y R^9 es H, ciclopropil o R^9 es CH_2R^{10} , donde R^{10} es H, (1C-2C)alkil, hidroxi(1C-2C)alkil, metoxi(1C-2C)alkil, ciclopropil.

6. Un compuesto de acuerdo a la reivindicación 5 caracterizado en que:

X es S;

R¹ es 3,5 difluorofenil, piridina-2-il, piridina-3-il, pirimidina-5-il, pirimidina-4-il, pirazina-2-il, 3-fluorofenil, 3-cianofenil, o 3-nitrofenil;

R² es 2-nitrofenil, 2-hidroximetil-fenil, 2-metoxifenil, 2-cianofenil o piridina-2-il;

R³ es H;

R⁵ es OH, (1C-2C)alkoxi, CN, CF₃, NO₂, hidroxi(1C-4C)alkil, CO₂(1C-4C)alkil, o NHR⁶ donde R⁶ es formil, acetil, fluoroacetil, difluoroacetil, o trifluoroacetil.

7. Un compuesto de acuerdo a la reivindicación 6 caracterizado en que:

R¹ es 3,5 difluorofenil, piridina-2-il, piridina-3-il; pirimidina-5-il, pirimidina-4-il, o pirazina-2-il;

R² es 2-nitrofenil, o 2-hidroximetil-fenil;

R⁵ es OH, (1C-2C)alkoxi, CN, hidroxi(1C-4C)alkil, o NHR⁶ donde R⁶ es formil, acetil, fluoroacetil, difluoroacetil, o trifluoroacetil.

8. Un compuesto de acuerdo a la reivindicación 7 caracterizado en que:

R¹ es 3,5 difluorofenil, piridina-2-il, piridina-3-il, pirimidina-5-il o pirimidina-4-il;

R² es 2-nitrofenil;

R⁵ es OH, (1C-2C)alkoxi, CN, o NHR⁶ donde R⁶ es formil, acetil, fluoroacetil, difluoroacetil, o trifluoroacetil.

9. Un compuesto de acuerdo a la reivindicación 8 seleccionado del grupo consistente de 6-Metoxi-3-(2-nitro-fenilsulfanil)-1-pirimidina-5-ilmetil-1H-indol, 3-(2-Nitro-fenilsulfanil)-1-piridina-2-ilmetil-1H-indol-6-carbonitrilo, 3-(2-Nitro-fenilsulfanil)-1-piridina-2-ilmetil-1H-indol-6-carbonitrilo-clorhidrato, 3-(2-Nitro-fenilsulfanil)-1-pirimidina-5-ilmetil-1H-indol-6-carbonitrilo, 3-(2-Nitro-fenilsulfanil)-1-pirimidina-4-ilmetil-1H-indol-6-carbonitrilo, N-[1-(3,5 difluoro-bencil)-3-(2-nitro-

fenilsulfanil)-1-*H*-indol-6-il]-2-fluoro-acetamida, y *N*-[3-(2-Nitro-fenilsulfanil)-1-pirimidina-5-ilmetil-1-*H*-indol-6-il]-formamida.

10. Un compuesto de acuerdo a la reivindicación 5, caracterizado en que:

X es S;

R¹ es 3,5 difluorofenil, piridina-2-il, piridina-3-il, 3-fluorofenil, 3-cianofenil, o 3-nitrofenil;

R² es 2-nitrofenil, o 2-hidroximetil-fenil, 2-metoxifenil, 2-cianofenil o piridina-2-il;

R³ es H;

R⁵ es C(O)N(R⁸,R⁹), donde R⁸ es H, y R⁹ es H o CH₂R¹⁰, donde R¹⁰ es H, (1C-2C)alkil, hidroxi(1C-2C)alkil, o metoxi(1C-2c)alkil.

11. Un compuesto de acuerdo a la reivindicación 10, caracterizado en que

R¹ es 3,5 difluorofenil, piridina-2-il o piridina-3-il;

R² es 2-nitrofenil, o 2-hidroximetil-fenil;

R⁵ es C(O)N(R⁸,R⁹), donde R⁸ es H, y R⁹ es H y R⁹ es CH₂R¹⁰, donde R¹⁰ es H, (1C-2C)alkil

12. Un compuesto de acuerdo a la reivindicación 11 el cual es metilamida del ácido 1-(3,5-Difluoro-bencil)-3-(2-nitro-fenilsulfanil)-1-*H*-indol-6-carboxílico.

13. Un compuesto de acuerdo a la reivindicación 4, caracterizado en que

X es S;

R¹ es 3,5 difluorofenil, piridina-2-il, piridina-3-il, 3-fluorofenil, 3-cianofenil, o 3-nitrofenil;

R² es 2-nitrofenil, 2-hidroximetil-fenil, 2-metoxifenil, 2-metoxifenil, 2-cianofenil o piridina-2-il;

R³ es H;

R^5 es $C(O)N(R^8, R^9)$, donde R^8 y R^9 cada uno independientemente son H o CH_2R^{10} ,

donde R^{10} es H, (1C-5C)alkil, (1C-5C)alkenil, hidroxi(1C-3C)alkil, (1C-3C)alkoxi(1C-3C)alkil o (mono- o di(1C-4C)alkil)aminometil

14. Un compuesto de acuerdo a la reivindicación 13, caracterizado en que

R^1 es 3,5 difluorofenil, piridina-2-il o piridina-3-il;

R^2 es 2-nitrofenil, o 2-hidroximetil-fenil;

R^5 es $C(O)N(R^8, R^9)$, donde R^8 y R^9 cada uno independientemente son H o CH_2R^{10} , donde R^{10} es H, (1C-5C)alkil, hidroxi(1C-3C)alkil, o (1C-3C)alkoxi(1C-3C)alkil.

15. Un compuesto de acuerdo a la reivindicación 14, el cual es dimetilamida del ácido

1-(3,5-Difluoro-bencil)-3-(2-nitro-fenilsulfanil)-1*H*-indole-6-carboxílico.

16. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 – 15 para usar en terapia.

17. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 1 –15 y un vehículo farmacéuticamente aceptable.

18. Una composición farmacéutica de acuerdo a la reivindicación 17 para el tratamiento de un desorden seleccionado del grupo consistente en desorden relacionado con el receptor andrógeno, un desorden andrógeno-relacionado e insuficiencia andrógena.

175

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 05-053827- -00002-0000
Fec 2006-05-26 17:03:46 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra 11 PATENTEIYI
EYE 379 PASNACIONALI
Ant 220 COTIAFIRMARION

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 06 - 38,492
FECHA : MAYO 22 DE 2006

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS ,	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	54982577	22/05/2006	34,522,500.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LENAS COMERCIALES	95,000.00
		TOTAL :	\$ 95,000.00

SON: NOVENTA Y CINCO MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Colo 11214 - 841 - 029 - 6