

ESCOBAR - URIBE ASOCIADOS

A B O G A D O S

Carrera 11A No. 94 76 OL305 PO Box 94948, Bogotá, D.C. Colombia

Tel. (571) 6162031 Fax (571) 6161889

www.escobaruribe.com - info@escobaruribe.com

255
245

2907/PCT

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E

S

D

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad 06-008093-00002-0000
Fec: 2006-05-19 14:07 21 Dep 2020 NUECREACIONES
Tra 11 PATENTE/II
Eve: 379 FASENACIONALI
Act 444 RESPUESTAREQUE Fec: 05 24

Ref Expediente No 06 008 093
Solicitud de Patente a nombre de
ALTANA PHARMA AG

Yo, JIMENA ESCOBAR URIBE, identificada como aparece al pie de mi firma, domiciliada en la carrera 11 A No 94-76, of 305, obrando como apoderada de la sociedad ALTANA PHARMA AG, domiciliada en Konstanz, Alemania, solicitante de la patente de la referencia, en respuesta al oficio No 3362 del 24 de mayo de 2006, me permito presentar los siguientes documentos

- 1 Copia del examen preliminar internacional Sobre el particular rectifico a ese despacho que la presente solicitud de patente corresponde al capítulo I del PCT
2. Documentos (3) en que constan la cesión del derecho a la patente otorgado por los inventores a favor de mi mandante Al respecto, informo a ese Despacho que por un error ortográfico se omitió el nombre de los inventores Matthias Vennemann, Thomas Bar y Jurgen Braunger, cuyas direcciones son Leinerstrasse 20, 78462 Konstanz, Alemania, Berggaessle 5, 78479 Reichenau, Alemania, Dorfriesenweg 26, 78465 Konstanz, Alemania. Adjunto igualmente extracto y tarjetas

Sobre el particular, es importante resaltar que de conformidad con las normas legales vigentes, artículo 1 de la Resolución 210 de 2001, expedida por el Superintendente de Industria y Comercio y artículo 2 de la Convención de la Haya, el documento en ingles que se pretenda aportar como parte de los tramites de propiedad industrial ante la Superintendencia de Industria y Comercio no requieren traducción Por otro lado, la legalizacion consular y/o diplomática de los documentos expedidos en el extranjero no es necesaria. Por lo tanto, los documentos de cesión anexos a este memorial son validamente presentados en idioma inglés con las correspondientes Apostillas traducidas de alemán y frances al español

Espero con esto haber dado cabal cumplimiento a lo solicitado por ese despacho y de conformidad con lo indicado en los articulos 3º, inciso 3, 35 inciso 2 y 59 inciso 2 del CCA, al analizar este memorial, atentamente ruego se traten todas las cuestiones planteadas con motivo del mismo

Señor Superintendente,


JIMENA ESCOBAR URIBE
C C 39 779 452 de Usaquén
T P 68228
Cod 5376

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY (Chapter I of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Rule 44bIs)

246 70
256

Applicant's or agent's file reference 1176WOORD01	FOR FURTHER ACTION		See item 4 below
International application No. PCT/EP2004/051307	International filing date (day/month/year) 30 June 2004 (30.06 2004)	Priority date (day/month/year) 30 June 2003 (30.06.2003)	
International Patent Classification (8th edition unless older edition indicated) See relevant information in Form PCT/ISA/237			
Applicant ALTANA PHARMA AG			

1	This international preliminary report on patentability (Chapter I) is issued by the International Bureau on behalf of the International Searching Authority under Rule 44 bis 1(a).		
2	This REPORT consists of a total of 9 sheets, including this cover sheet. In the attached sheets, any reference to the written opinion of the International Searching Authority should be read as a reference to the international preliminary report on patentability (Chapter I) instead.		
3	This report contains indications relating to the following items		
	☒ Box No. I	Basis of the report	
	☒ Box No. II	Priority	
	☒ Box No. III	Non-establishment of opinion with regard to novelty inventive step and industrial applicability	
	☐ Box No. IV	Lack of unity of invention	
	☒ Box No. V	Reasoned statement under Article 35(3) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability citations and explanations supporting such statement	
	☐ Box No. VI	Certain documents cited	
	☐ Box No. VII	Certain defects in the international application	
	☒ Box No. VIII	Certain observations on the international application	
4	The International Bureau will communicate this report to designated Offices in accordance with Rules 44bis.3(c) and 93bis 1 but not, except where the applicant makes an express request under Article 23(2), before the expiration of 30 months from the priority date (Rule 44bis 2).		

The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland Facsimile No. +41 22 740 14 35	Date of issuance of this report 03 January 2006 (03.01 2006)
	Authorized officer Ellen Moyse Telephone No +41 22 338 89 75

Form PCT/IB/373 (January 2004)

**DOCUMENTO DE CESIÓN
ASSIGNMENT DOCUMENT**

El (los) suscrito (s) en su calidad de inventor (es) de *"Pyrrolo dihydroisoquinolinas como inhibidoras de PDE 10"*
declara(n) que cede (n) y traspasa (n) todos los derechos que les correspondan en y sobre el
invento atrás mencionado a ALTANA Pharma AG una compañía constituida y existente bajo las
leyes de Alemania, domiciliada en 78467 Konstanz Byk-Gulden-Str 2 Alemania correspondiente
al expediente No 06. 008. 093 > en cuanto se refiere a la República de Colombia

The undersigned as inventor (s) of

PYRROLODIHYDROISOQUINOLINES AS PDE10 INHIBITORS

hereby declare (s) that assign (s) all the rights in and to the aforementioned invention to ALTANA
Pharma AG, a company incorporated and existing in conformity with the laws of Germany
domiciled at 78467 Konstanz Byk-Gulden-Str 2 Germany corresponding to file No
> as far as the Republic of Colombia is concerned

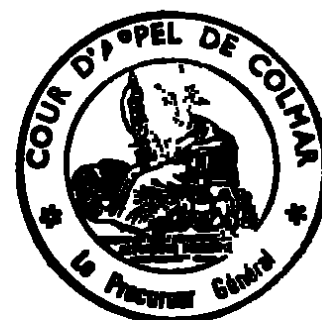
Matthias VENNEMANN
domiciled at Leinerstr 20 78462 Konstanz Germany

Thomas BÄR
domiciled at Berggässle 5, 78479 Reichenau Germany

Thomas MAIER
domiciled at Panoramaweg 31, 78333 Stockach Germany

Ulrich GRÄDLER
domiciled at Fichtestr 15 69126 Heidelberg Germany

Jürgen BRAUNGER
domiciled at Dorfriesenweg 26 78465 Konstanz Germany



Petra GIMMICH

domiciled at Sonnenbühlstr 58 78464 Konstanz Germany

Gianluca QUINTINI

domiciled at Eichhornstr 51 78464 Konstanz Germany

Paola CIAPETTI

domiciled at 12 Route des Romains 67120 ALTORF France

Jean-Marie CONTRERAS

domiciled at 7d, Rue du Petit Rempart 67230 BENFELD France

Camille Georges WERMUTH

domiciled at 3 Rue de la Cote d'Azur 67100 STRASBOURG France

CERTIFIE véritables les signatures apposées ci-dessus en ma présence de

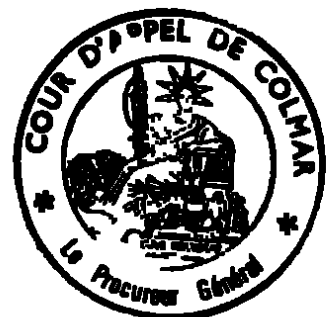
- Madame Paola CIAPETTI, domiciliée à ALTORF (67120) 12 route des Romains (France), chimiste, titulaire du passeport n° A971905 délivré le 13 octobre 2003 par la République Italienne, et expirant le 12 octobre 2013
- Monsieur Jean Marie Georges CONTRERAS, domicilié à BENFELD (67230) 7d rue du Petit Rempart (France), chimiste, titulaire de la carte nationale d'identité n° 980667500207 délivrée le 04 juin 1998 par la Sous-Préfecture de SELESTAT ERSTEIN(Bas-Rhin), et expirant le 03 juin 2008
- Monsieur Camille Georges WERMUTH, domicilié à STRASBOURG (67100) 3 rue de la Côte d'Azur (France), chimiste, titulaire de la carte nationale d'identité n° 030567802263 délivrée le 21 mai 2003 par la Préfecture du Bas-Rhin, et expirant le 20 mai 2013

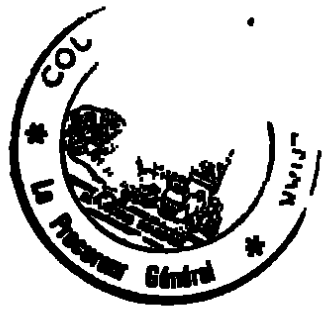
A ILLKIRCH GRAFFENSTADEN

Le trois février deux mil six



[Handwritten signature]





APOSTILLE
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

--- Colombie ---

1 République française

Le présent acte public:

2 - a été signé par, M. Feitsch

3 - agissant en qualité de Notaire

4 - est revêtu du sceau de son étude en
la ville de Illersheim - Graffenhoden 67

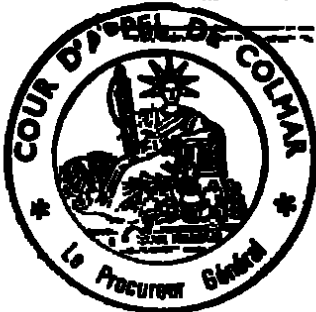
Attesté

5 - à COLMAR 6 - le 07/02/06

7 - Par le Procureur général près la cour d'appel

8 - sous n° 518/06

1) Sceau 10) Signature



[Signature]
François JURDEY
Avocat Général

205
249

Petra GIMMICH

Domiciliado en Sonnenbühlstr 58, 78464 Konstanz, Alemania

Gianluca QUINTINI

Domiciliado en Eichhornstr 51, 78464 Konstanz, Alemania

Paola CIAPETTI

Domiciliado en 12, Route des Romans, 67120 ALTORF, Francia

Jean- Marie CONTRERAS

Domiciliado en 7d, Rue du Petit Rempart, 67230 BENFELD, Francia

Camille Georges WERMUTH

Domiciliado en 3, Rue de la Cote d'Azur, 67100 STRASBOURG, Francia

CERTIFICO genuinas las firmas puestas en mi presencia de

- La Señora Paola CIAPETTI, domiciliado en ALTORG (67120) 12 route des Romans (Francia), química, titular del pasaporte No A971905 expedido el 13 de octubre de 2003 por la Republica Italiana, y expira el 12 de octubre de 2013
- El Señor Jean Marie Georges Contreras, domiciliado en benfeld (67230) 7d rue du Petit Rempart (Francia), químico, titular de la tarjeta nacional de identidad No 980667500207 expedido el 4 de junio 1998 por el sub- Prefectura

Resolución
8694/78
Ministerio de

Clemencia Perdomo Tejeda
TRANSDUCTOR OPTICO

ENC. Y REC. I
ARCHIVO TRANSACCIONES

- 260
250
- El Señor Camilla georges Wermuth, domiciliado en STRASBOURG (67100) 3 rue de la Côte d'Azur (Francia), químico, titular de la tarjeta nacional de identidad No 030567802263 expedida el 21 de mayo de 2003 por la Prefectura de Bas-Rhin y expira el 20 de mayo de 2013

A ILLKIRCH GRAFFENSTANDEN

El 3 de febrero de 2006

Sello y firma de Benoît Fritsch, Notario

Sello de la Corte de Apelaciones de Colmar

APOSTILLA

CONVENCIÓN DE LA HAYA DEL 5 DE OCTUBRE DE 1961

1 REPUBLICA FRANCESA

LA PRESENTE ACTA PUBLICA

2 HA SIDO FIRMADA POR FRITSCH

3 ACTUANDO EN CALIDAD DE NOTARIO

4 LLEVA EL SELLO DE LA NOTARIA DE LA CIUDAD DE ILLKIRCH

GRAFFENSTANDEN 63

CERTIFICADO

5 EN COLMAR

6 EL 07/02/06

7 POR EL PROCURADOR GENERAL DE LA CORTE DE APELACIONES

8 BAJO EL NUMERO 518/06

9 SELLO DE LA CORTE DE APELACIONES DE COLMAR

10 FIRMADO, FRANÇOIS JURDEY

ABOGADO GENERAL

Resolución
6694/78
Ministerio

Clemencia Paredes Tejeda
TRADUCTORA OFICIAL
ENGLISH FRENCH SPANISH
ANGLAIS FRANCAIS ESPANOL

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

4 2 6 8 4 3
Clemencia Paredes
CADA FOLIO DEBE APARECER EN EL
DOCUMENTO DE EMPLEO
LAS FUNCIONES INDICADAS

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2006 MAR 14 A 10 54
Cilia
JEFE DE LEGALIZACIONES
BOGOTÁ D.C.

290726
251

1176COPCT01

**DOCUMENTO DE CESIÓN
ASSIGNMENT DOCUMENT**

El (los) suscrito (s) en su calidad de inventor (es) de **"Pyrrolodihidroisoquinolinas como inhibidores de PDE 10"**
declara(n) que cede (n) y traspasa (n) todos los derechos que les correspondan en y sobre el
invento atrás mencionado a **ALTANA Pharma AG** una compañía constituida y existente bajo las
leyes de Alemania domiciliada en 78467 Konstanz Byk-Gulden-Str 2 Alemania correspondiente
al expediente No **06.008.093** > en cuanto se refiere a la Republica de Colombia

The undersigned as inventor (s) of

PYRROLODIHYDROISOQUINOLINES AS PDE10 INHIBITORS

hereby declare (s) that assign (s) all the rights in and to the aforementioned invention to **ALTANA
Pharma AG**, a company incorporated and existing in conformity with the laws of Germany
domiciled at 78467 Konstanz Byk-Gulden-Str 2 Germany corresponding to file No
> as far as the Republic of Colombia is concerned

Matthias VENNEMANN

domiciled at Leinerstr 20 78462 Konstanz Germany

Thomas BÄR

domiciled at Berggässle 5 78479 Reichenau Germany

Thomas MAIER

domiciled at Panoramaweg 31, 78333 Stockach Germany


Ulrich GRADLER

domiciled at Fichtestr 15 69126 Heidelberg Germany

Jürgen BRAUNGER

domiciled at Dorfwesenweg 26 78465 Konstanz Germany

Petra GIMMICH
domiciled at Sonnenbühlstr 58 78464 Konstanz Germany

Gianluca QUINTINI
domiciled at Eichhornstr 51 78464 Konstanz Germany

Paola CIAPETTI
domiciled at 12 Route des Romains 67120 ALTORF France

Jean-Marie CONTRERAS
domiciled at 7d Rue du Petit Rempart, 67230 BENFELD France

Camille Georges WERMUTH
domiciled at 3 Rue de la Cote d'Azur 67100 STRASBOURG France

Notariat 8 Heidelberg

Vangerowstraße 18, 69115 Heidelberg Tel 06221/891880 Fax: 06221/892248 E-Mail: joerg.schaefer@notarheidelberg.justiz.bwl.de

86R40106

253

Die Kosten werden gemäß
Kostenordnung erhoben.

Just.-Angestellte



Unterschriftsbeglaubigung

I

Ich beglaubige als echt vorstehende eigenhändig vor mir vollzogene Unterschrift des durch Bundespersonalausweis ausgewiesenen

Herrn Ulrich Stefan Grädler, geboren am 13.07.1971, Fichtestraße 15,
69126 Heidelberg

II la Translacion

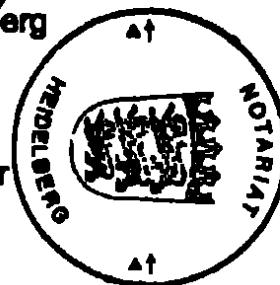
Doy fe de la autenticidad de la firma que antecede, estampada ante mí por

Señor Ulrich Stefan Grädler,
nato 13 Julio 1971,
la dirección Fichtestraße 15, 69126 Heidelberg

según acredita mediante su documento nacional de identidad

Heidelberg, den 11.01.2006
Notariat 8 Heidelberg

Schaefer, Notar



Dokument19

254
204

Apostille

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1 Land Bundesrepublik Deutschland

Diese öffentliche Urkunde

2 ist unterschrieben von Justizrat Schaefer

3 in seiner Eigenschaft als Notar beim Notariat Heidelberg

4 sie ist versehen mit dem Siegel/Stempel
des(der) Notariats Heidelberg

Bestätigt

5 in Heidelberg

6 am 11 Januar 2008

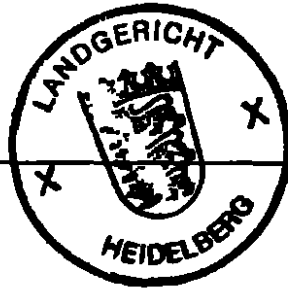
7 durch Vizepräsident des Landgerichts Knoblich

8 unter Nr E 910 a - 29/08

9 Siegel/Stempel

10 Unterschrift

Knoblich



253
252

APOSTILLE

(Convention de la Haye du 5 octobre 1961)

1 Pais República Federal de Alemania

El presente documento publico

2 Ha sido firmado por el consejero judicial Schaefer

3 Actuando en calidad de notario público de la notaria de Heidelberg

4 Lleva el sello / estampilla de notaria de Heidelberg

Certificado

5 en Heidelberg

6 el 11 de enero de 2006

7 por el vicepresidente del Tribunal Regional Knoblich

8 bajo el N° E 910 a - 29/06

**9 Sello Tribunal Regional de
Heidelberg**

**10 Firma
Knoblich**



**ADOLF WATZKE
Traductor Oficial
Res. 2433 Minjusticia**

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

426844
Adolfo Watzke
Jefe de Delegación en el
Extranjero
DOCUMENTO DESEMPENA
LAS FUNCIONES INDICADAS

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2006 10 14 A 10 54
Cuba
JEFE DE DELEGACIONES
BOGOTA D.C.

**DOCUMENTO DE CESIÓN
ASSIGNMENT DOCUMENT**

El (los) suscrito (s) en su calidad de inventor (es) de *"Pirrolodihidroisoquinolinas como inhibidores de PDE10"*
declara(n) que cede (n) y traspasa (n) todos los derechos que les correspondan en y sobre el
invento atrás mencionado a ALTANA Pharma AG una compañía constituida y existente bajo las
leyes de Alemania domiciliada en 78467 Konstanz Byk-Gulden-Str 2 Alemania correspondiente
al expediente No *06, 008, 093* > en cuanto se refiere a la República de Colombia

The undersigned as inventor (s) of

PYRROLODIHYDROISOQUINOLINES AS PDE10 INHIBITORS

hereby declare (s) that assign (s) all the rights in and to the aforementioned invention to ALTANA
Pharma AG, a company incorporated and existing in conformity with the laws of Germany,
domiciled at 78467 Konstanz Byk-Gulden-Str 2 Germany corresponding to file No
> as far as the Republic of Colombia is concerned

78462 Konstanz, 27 Jan 2006

Matthias Vennemann
Matthias VENNEMANN
domiciled at Leinerstr 20 78462 Konstanz Germany

Thomas Bar
Thomas BAR
domiciled at Berggässle 5 78479 Reichenau Germany

Thomas Maier
Thomas MAIER
domiciled at Panoramaweg 31, 78333 Stockach Germany

Ulrich Grädler
Ulrich GRÄDLER
domiciled at Fichtestr 15 69126 Heidelberg Germany

Jürgen Fraunger
Jürgen FRAUNGER
domiciled at Dorfriesenweg 28 78465 Konstanz Germany

267
257

Petra Gimmnich

Petra GIMMNICH
domiciled at Sonnenbühlstr 58 78464 Konstanz Germany

G. Quintini

Gianluca QUINTINI
domiciled at Eichhornstr 51 78464 Konstanz Germany

Paola CIAPETTI

domiciled at 12 Route des Romains 67120 ALTORF France

Jean-Marie CONTRERAS

domiciled at 7d Rue du Petit Rempart 67230 BENFELD France

Camille Georges WERMUTH

domiciled at 3 Rue de la Cote d'Azur 67100 STRASBOURG France

Notariat I Konstanz

• **IUR 189 / 2006**

189

258

Certification of Signature

This is to certify that before me, Stephan Randt, Notary Public in and for Konstanz, Germany, duly admitted and sworn in, there appeared this day

- Identified by german passport -

- 1 **Herr Gianluca Quintini**, born 26 09 1967,
address **Elchhornstr 51, 78464 Konstanz**,
- 2 **Frau Petra Gimmlich geb Lorenz**, born 25 03 1966,
address **Sonnenbühlstr 58, 78464 Konstanz**,
- 3 **Herr Dr Thomas Maler**, born 02 08 1966,
address **Pannoramaweg 31, 78333 Stockach**,
- 4 **Herr Dr Thomas Bär**, born 04 11 1961,
address **Berggässle 5, 78479 Reichenau**,
- 5 **Herr Dr Matthias Vennemann**, born 06 04 1973,
address **Leinerstr 20, 78462 Konstanz**,
- 6 **Herr Dr Jürgen Braunger**, born 10 04 1967,
address **Dorfwiesenweg 26, 78465 Konstanz**,

acknowledged the foregoing signatures as their free act and deed

Randt, Notary Public

Notariat I Konstanz

D-78462 Konstanz 27th January 2006



259

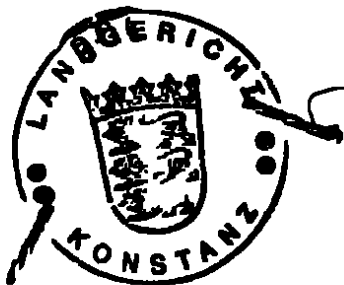
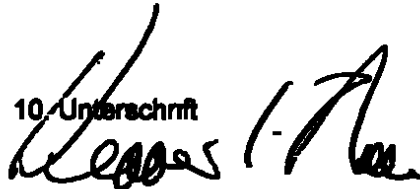
Apostille

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

- 1 Land Bundesrepublik Deutschland
Diese öffentliche Urkunde
- 2 ist unterschrieben von
Oberjustizrat Randt
- 3 in seiner Eigenschaft als
Notar
- 4 sie ist versehen mit dem Dienststempel und -siegel
des Notariats Konstanz

Bestätigt

- 5 in Konstanz
- 6 am 01 02 2006
- 7 durch Vizepräsident des Landgerichts Deppert-Kern
beim Landgericht Konstanz
- 8 unter Nr E 910 a (AR 115/06)
- 9 Siegel/Stempel
- 10 Unterschrift



260

APOSTILLE

(Convention de la Haye du 5 octobre 1961)

1 Pais **República Federal de Alemania**

El presente documento publico

2 Ha sido firmado por **el consejero judicial superior Randt**

3 Actuando en calidad de **notario público**

4 Lleva el sello / estampilla de **la notaria de Constanza**

Certificado

5 en **Constanza**

6 el **1 de febrero de 2006**

7 por **el vicepresidente del Tribunal Regional Deppert-Kern**
ante el Tribunal Regional de Constanza

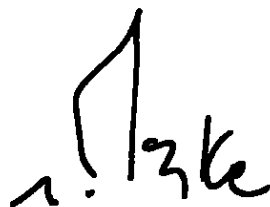
8 bajo el N° **E 910 a (AR 115/06)**

9 Sello

Tribunal Regional de Constanza

10 Firma

Deppert-Kern



ADOLF WATZKE
Traductor Oficial
Res. 2483 Minjusticia

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

426845
Adolf Watzke
COYA FIRMA EN EL
DOCUMENTO DESEMPLEA
LAS FUNCIONES INDICADAS

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

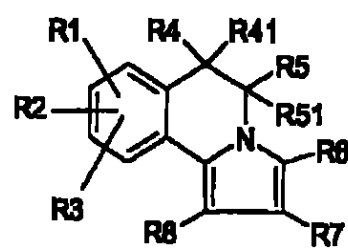
2006 MAR 14 A 10:54
Cilia
JEFE DE LEGALIZACIONES
BOGOTÁ D.C.

27
261

Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO DIVISION DE NUEVAS CREACIONES EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION PCT	
(21) N° de solicitud (22) Fecha de solicitud (30) Prioridad Oficina de Patentes Europea (31) No. Prioridad 03014424.0 (32) Fecha 30/06/03 (33) País EP	(51) Int Cl C07D 471/04 (71) Solicitante(s) ALTANA PHARMA AG. (72) Inventor(es) MAIER, Thomas // GRAEDLER, Ulrich // GIMMICH, Petra // QUINTINI, Gianluca // CIAPETTI, Paola // CONTRERAS, Jean-Marie // WERMUTH, Camille Georges // VENNEMANN, Matthias // BÄR, Thomas // BRAUNGER, Jürgen (74) Agente JIMENA ESCOBAR URIBE
(85) Fecha inicio fase nacional (86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT Fecha de presentación de la solicitud Fecha 30/06/04 No. de solicitud PCT/EP2004/051307	(87) Publicación internacional Fecha Fecha (dd/mm/aa) N° publicación: WO 2005/003129 A1 de 13/01/05
(54) Título: PIRROLODIHIDROISOQUINOLINAS COMO INHIBIDORES DE PDE10	

Reivindicación(es)

1 Compuestos de fórmula I



caracterizados porque

R1 es halógeno, nitró, amino, mono- o di-alquil de C₁-C₄-amino, alquilo de C₁-C₄, hidroxilo, alcoxi de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄-alcoxi de C₂-C₄, cicloalcoxi de C₃-C₇, cicloalquilmetoxi de C₃-C₇, o alcoxi de C₁-C₄ substituido completamente o predominantemente por flúor,

262

R2 es hidrógeno, halógeno o alcoxi de C₁-C₄, y

R3 es hidrógeno o alcoxi de C₁-C₄, o

R2 y R3 enlazados a la porción del anillo benzo en posición orto uno con respecto a otro juntos forman un puente de alquilendioxi de C₁-C₂, o

R2 y R3 enlazados a la porción del anillo benzo en posición orto uno con respecto a otro juntos forman un puente de alquilendioxi de C₁-C₂ substituido completamente o predominantemente por flúor, o

R1 y R2 enlazados a la porción del anillo benzo en posición orto uno con respecto a otro juntos forman un puente de alquilendioxi de C₁-C₂, y R3 es hidrógeno, o

R1 y R2 enlazados a la porción del anillo benzo en posición orto uno con respecto a otro juntos forman un puente de alquilendioxi de C₁-C₂ substituido completamente o predominantemente por fluor y R3 es

170

hidrógeno, o,

R1 y R2 enlazados a la porción del anillo benzo en posición orto uno con respecto a otro juntos forman un puente de alquilendioxi de C₁-C₂, y R3 es hidrógeno, o

R1 y R2 enlazados a la porción del anillo benzo en posición orto uno con respecto a otro juntos forman un puente de alquilendioxi de C₁-C₂ substituido completamente por flúor y R3 es

hidrógeno

R4 es hidrógeno fluor cloro alquilo de C₁-C₄ trifluorometilo
ciclopropilo ciano alcóxicarbonilo de C₁-C₄ o -CH₂-O-R411 en la cual

R411 es hidrógeno alquilo de C₁-C₄ alcóxi de C₁-C₄-alquilo de C₂ C₄

5 o alquil de C₁-C₄-carbonilo

R41 es hidrógeno o alquilo de C₁-C₄,

R5 es hidrógeno, fluor o alquilo de C₁-C₄, y

R51 es hidrógeno o alquilo de C₁-C₄

o

10 R4 es hidrógeno fluor cloro o alquilo de C₁-C₄

R41 es hidrógeno o alquilo de C₁-C₄

R5 es hidrógeno, fluor alquilo de C₁-C₄ trifluorometilo ciclopropilo
ciano alcóxi de C₁-C₄-carbonilo o -CH₂-O-R511 en la cual

R511 es hidrógeno alquilo de C₁-C₄, alcóxi de C₁-C₄-alquilo de C₂ C₄

15 o alquil de C₁-C₄-carbonilo y

R51 es hidrógeno o alquilo C₁-C₄ o

R4 y R5 juntos forman un puente de alquileo de C₁-C₄ y R41 y R51
son ambos hidrógeno

20 R6 es alquilo de C₁-C₈ amino formilo o alquilo de C₁-C₄ substituido
con R61 en el cual

R61 es alcóxi de C₁-C₄-carbonilo carboxilo alcóxi de C₁-C₄
hidroxilo halógeno o -N(R611)R612 en la cual

R611 es hidrógeno alquilo de C₁-C₄ cicloalquilo de C₃-C₇ o
cicloalquilo de C₃-C₇-alquilo de C₁-C₄ y R612 es hidrógeno o alquilo de C₁-

25 C₄ o

274
264

R611 y R612 juntos y con la inclusión del átomo de nitrógeno al cual están unidos forman un radical Het1 en el cual

Het1 es un radical de anillo heterocíclico saturado de 5 a 7 miembros que comprende un átomo de nitrógeno al cual están unidos R611 y R612 y
5 opcionalmente un heteroátomo adicional seleccionado a partir de un grupo que consiste de nitrógeno oxígeno y azufre y opcionalmente substituido con R613 en un átomo de nitrógeno del anillo en el cual

R613 es alquilo de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₇, cicloalquilo de C₃-C₇-
alquilo de C₁-C₄ hidroxialquilo de C₂-C₄ alcoxi de C₁-C₄-alquilo de C₂-C₄
10 aminoalquilo de C₂-C₄ mono- o di-alquilamino de C₁-C₄-alquilo de C₂-C₄
formilo piridilo o pirimidinilo

R7 es fenilo Het2 fenilo substituido con R71 y/o R72 y/o R73 Het2
substituido con R74 y/o R75 naftilo o naftilo substituido con R76 y/o R77
en el cual

15 Het2 es ya sea

un radical heteroarilo de 5 a 10 miembros monocíclico o bicíclico
fusionado que comprende uno a tres heteroátomos cada uno de los cuales
está seleccionado a partir de un grupo que consiste de nitrógeno oxígeno y
azufre,

20 o

un radical de anillo heterocíclico de 9 ó 10 miembros, bicíclico
fusionado parcialmente saturado que contiene un anillo benceno y que
comprende uno o dos heteroátomos cada uno de los cuales seleccionado a
partir de un grupo que consiste de nitrógeno oxígeno y azufre o

25 N-oxi-piridilo,

265

R71 es hidroxilo, halógeno, nitro, ciano, trifluorometilo, alquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄, amino mono- o di- alquil de C₁-C₄-amino, alquil de C₁-C₄-sulfonilamino, arilsulfonilamino, alcoxi de C₁-C₄-carbonilo, carboxilo, alquil de C₁-C₄-tio, ariloxi-alcoxi de C₂-C₄, ariloxi-alquilo de C₁-C₄, ariloxi aril-alcoxi de C₁-C₄, arilo, alcoxi de C₁-C₄-alcoxi de C₂-C₄, alcoxi de C₁-C₄, alquilo de C₁-C₄, hidroxialcoxi de C₂-C₄, aminoalcoxi de C₂-C₄, mono o di-alquilamino de C₁-C₄-alcoxi de C₂-C₄, alcoxi de C₁-C₄, substituido completamente o predominantemente por flúor, mono- o di-alquil de C₁-C₄--aminocarbonilo, carbamilo, tetrazolilo, o -N(H)S(O)₂-N (R712)R713 en la

10 cual

arilo es fenilo o fenilo substituido con R711 en el cual

R711 es halógeno, alquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄, nitro o ciano

R712 es alquilo de C₁-C₄, y

R713 es alquilo de C₁-C₄, o

15 R712 y R713 juntos y con la inclusión del átomo de nitrógeno al cual están unidos forman un radical Het3 en la cual

Het3 es pirrolidin-1-ilo, piperidin-1-ilo o morfolin-4-ilo

R72 es halógeno, alquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄, o alcoxi de C₁-C₄-carbonilo,

20 R73 es alquilo de C₁-C₄, o alcoxi de C₁-C₄,

R74 es halógeno, alquilo de C₁-C₄, trifluorometilo, alcoxi de C₁-C₄, ciano, amino mono- o di-alquil de C₁-C₄-amino, alcoxi de C₁-C₄-carbonilo, morfolino, carboxilo, nitro, fenilo, feniloxi, fenilalquilo de C₁-C₄, arilsulfonilo, alquil de C₁-C₄-sulfonilo, o -S(O)₂-N(R712)R713

25 R75 es alquilo de C₁-C₄, o halógeno

266

R76 es halógeno hidroxilo alquilo de C₁-C₄ alcoxi de C₁-C₄ carboxilo o alcoxi de C₁-C₄-carbonilo,

R77 es alquilo de C₁-C₄ o alcoxi de C₁-C₄,

R8 es alquilo de C₁-C₄ fenilo alquinilo de C₂-C₄ ciano -CH₂ O-R81
5 fenilcarbonilo -C(O)-N(R82)R83 o -C(O)-OR9 en la cual

R81 es hidrógeno alquilo de C₁-C₄ alcoxi de C₁-C₄-alquilo de C₂-C₄ o alquil de C₁-C₄-carbonilo

R82 es hidrógeno alquilo de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₇ cicloalquil de C₃-C₇-alquilo de C₁-C₄ fenilo o fenilalquilo de C₁-C₄ y

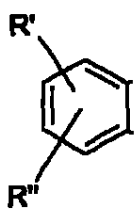
10 R83 es hidrógeno o alquilo de C₁-C₄ o

R82 y R83 juntos y con la inclusión del átomo de nitrógeno al cual están unidos forman un radical de anillo heterocíclico seleccionado a partir del grupo que consiste de pirrolidinilo piperidinilo morfolinilo o N (alquilo de C₁-C₄) -piperazinilo

15 R9 es hidrógeno o alquilo de C₁-C₄

bajo la primera condición que este subgrupo de compuestos de fórmula I en donde aplica la combinación de todas las siguientes restricciones a) a c) no sea reclamado

a) el modelo de sustitución del anillo benzo substituido con R1 y/o
20 R2 y/o R3 izquierdo de la porción dihidroisoquinolina del escenario de la pirrolodihidroisoquinolina mostrado en la fórmula I es como sigue



en la cual

R y R' pueden estar enlazados en cualquier posición posible del anillo benzo y

R' es hidroxilo, alcoxi de C₁-C₄ o trifluorometoxi

5 R" es hidrógeno o alcoxi de C₁-C₄ o

R' y R" enlazados a la porción del anillo benzo en posición orto uno con respecto a otro juntos forman un puente alquilendioxi de C₁-C₂ y

b) R₄ es hidrógeno y

R₄₁ es hidrógeno, y

10 R₅ es hidrógeno y

R₅₁ es hidrógeno, y

c) R₈ es -C(O)-OR₉ en la cual

R₉ es alquilo de C₁-C₄,

y bajo la segunda condición, que cuando R₅ y R₅₁ sean ambos hidrógeno

15 entonces

R₈ es diferente de fenilo fenilcarbonilo -C(O)-N(R₈₂)R₈₃ o -C(O)-OR₉ en la cual

R₈₂ es hidrógeno alquilo de C₁-C₄ cicloalquilo de C₃-C₇ cicloalquil de C₃-C₇-alquilo de C₁-C₄ fenilo o fenilalquilo de C₁-C₄

20 R₈₃ es hidrógeno o alquilo de C₁-C₄ o

R₈₂ y R₈₃ juntos y con la inclusión del átomo de nitrógeno al cual están unidos forman un radical de anillo heterocíclico seleccionado a partir del grupo que consiste de pirrolidinilo piperidinilo morfolinilo o N-(alquilo de C₁-C₄)-piperazinilo y

25 R₉ es alquilo de C₁-C₄

268

y las sales estereoisómeros hidratos e hidratos de las sales de estos compuestos

279
269

		SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO		
Industria y Comercio		DIVISION DE NUEVAS CREACIONES		
SUPERINTENDENCIA		TARJETA ARCHIVO TEMATICO		
PATENTE DE INVENCION		PCT ☒	MODELO DE UTILIDAD ☐ DISEÑO INDUSTRIAL ☐	
(21) N° de solicitud:		(22) Fecha de solicitud		
(51) Clasificación Internacional C07D 471/04		FIGURA CARACTERISTICA 6 x 6 cm		
(71) Solicitante (es)				
ALTANA PHARMA AG				
(72) Inventor(es)				
MAIER Thomas // GRAEDLER Ulrich // GIMMICH Petra // QUINTINI Gianluca // CIAPETTI Paola // CONTRERAS Jean-Marie // WERMUTH Camille Georges // VENNEMANN Matthias // BÄR, Thomas // BRAUNGER, Jürgen				
(74) Agente:		JIMENA ESCOBAR URIBE		
(30) Prioridad		(31) No Prioridad	(32) Fecha	(33) País
Oficina de Patentes Europea		03014424 0	30/08/03	EP
(85) Fecha inicio fase nacional:		(87) Publicación internacional		
(86) Datos relativos a la presentación de la solíc PCT		Fecha: 13/01/05		
Fecha de presentación de la solicitud 30/08/04		No Publicación WO 2005003129 A1		
No de solicitud PCT/EP2004/051307				
(54) Título				
PIRROLODIHIDROISOQUINOLINAS COMO INHIBIDORES DE PDE10				
(57) Resumen				
La invención se refiere a derivados novedosos de pirrolodihidroisoquinolina los cuales son inhibidores eficaces de PDE10				

270 280

		SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
Industria y Comercio		DIVISION DE NUEVAS CREACIONES	
SUPERINTENDENCIA		TARJETA ARCHIVO PROPIETARIOS	
PATENTE DE INVENCION		PCT ☒ MODELO DE UTILIDAD	
DISEÑO INDUSTRIAL			
(21) Nº de solicitud		(22) Fecha de solicitud	
(51) Clasificación internacional C07D 471/04			
(71) Solicitante (es)		ALTANA PHARMA AG	
(72) Inventor (es)		MAIER, Thomas // GRAEDLER Ulrich // GIMMICH Petra // QUINTINI Gianluca // CIAPETTI Paola // CONTRERAS Jean-Marie // WERMUTH Camille Georges // VENNEMANN Matthias // BÄR, Thomas // BRAUNGER, Jürgen	
(74) Agente:		JIMENA ESCOBAR URIBE	
(30) Prioridad		(31) No. Prioridad	
Oficina de Patentes Europea		03014424 0	
		32) Fecha	
		30/08/03	
		(33) País	
		EP	
(85) Fecha inicio fase nacional		(87) Publicación internacional	
(88) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT		Fecha. Fecha (dd/mm/aa)	
Fecha de presentación de la solicitud Fecha (dd/mm/aa)		Nº publicación WO 2005/003129 A1 de 13/01/05	
No de solicitud PCT/EP2004/051307 de 30/08/04			
(54) Título:		PIRROLODIHIDROISOQUINOLINAS COMO INHIBIDORES DE PDE10	

271

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCI

Folio 291

2020
Bogotá D C ,

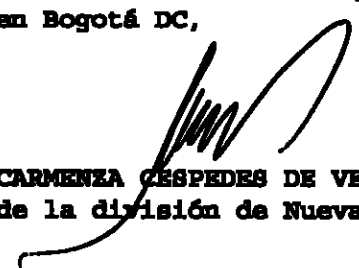
Doctor(a)
ESCOBAR URIBE JIMENA
Apoderado(a) y/o Representante de
ALTANA PHARMA AG

REFERENCIA	Radicación No	06 8093
	Solicitud internacional	PCT/EP2004/051307
	Fecha inicio fase nacional	30/01/06
	Trámite	11
	Evento	379
	Actuación	416
	Oficio No	2521
	Folios	1

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 la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, el Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), el Reglamento y la Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de Comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial

Cúmplase
Dado en Bogotá DC,

05 FEB 2007


ALIX CARMONA CESPEDES DE VERGEL
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

projas