



No. 06-094721 - 00003-0000

Fecha: 2007-09-19 16:51:19 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 17

BOGOTA - COLOMBIA
OFICINA FUNDADA EN 1941
APARTADO AEREO 12304
TEL: 57-1-3264270 57-1-6069700
FAX: 57-1-3264271 57-1-6069701
CABLES: LLOREDA
CALLE 72 No. 5-83 5º. PISO
www.lloredacamacho.com
jlcco@lloredacamacho.com

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

Re: P1.-GLAXO GROUP LIMITED.-Solicitud de Patente de Invención
Fase Nacional PCT para "COMPUESTO DE PIRAZOLO
[3,4-B]PIRIDINA, Y SU USO COMO UN INHIBIDOR DE PDE4".-
Clase C07D 487/04.-Expediente número 06-094.721.-

1. Me refiero a mi memorial radicado ante ese Despacho el 10 de Enero de 2007.

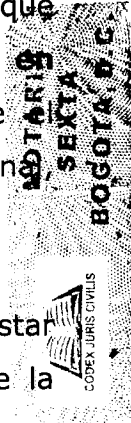
2. Debidamente autorizado por mi representado, y siguiendo los lineamientos de la respuesta emitida por ese Despacho al Derecho de Petición cuyo número de radicación es 07-089.021, me permito allegar el capítulo reivindicatorio que **deberá ser tenido en cuenta para el trámite de la presente solicitud en Fase Nacional**, y en el cual constan las modificaciones voluntarias que solicitante realizó al capítulo reivindicatorio presentado en Fase Internacional junto con el pago de la tasa correspondiente.

En relación con la anterior modificación, atentamente me permito manifestar a ese Despacho que la misma **no amplía** de manera alguna el alcance de la presente invención.

3. Anexo me permito presentar:

(a) Formulario único de correcciones y modificaciones;

(b) Recibo número 07-74,048, expedido por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago de la modificación mencionada; y



(c) Copia del capítulo reivindicatorio que reemplaza aquel presentado en Fase Internacional.

4. Ruego a usted tomar atenta nota de lo anterior y proceder de conformidad.

Señor Superintendente,



ALICIA LLORED & CIA. S. A.

T.P. 53.215

NOTARIA SEXTA DE BOGOTÁ
RECONOCIMIENTO Y PRESENTACION PERSONAL
Bogotá, D.C. 18 SEP 2007
Ante mí JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTÁ

Comparecieron: Alicia Lloreda Ricaurte

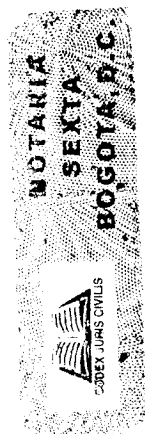
quien así exhibió (aron) la(s) C.C.
CC 7 39 690 713 Usaquén
TP. 53215

y declaró (n) que (n) firma(s) que aparece(n)
en el presente documento es (son) la(s) suya (s) y
que el contenido del mismo es cierto. En constancia se firma esta diligencia



ALICIA LLORED & CIA. S. A.

C.C. No. 39.690.713 de Usaquén



FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES.
2000-10

①

SOLICITUD DE:

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Solicitud.

②

SOLICITANTE

Nombre: **GLAXO GROUP LIMITED**, sociedad existente y organizada de conformidad con las leyes de Inglaterra y Gales.

Dirección: Glaxo Wellcome House, Berkeley Avenue, Greenford Middlesex UB6 0NN, Inglaterra.

Teléfono: 3 264270 Fax: 6 069701

E-mail: jllcco@lloredacamacho.com

Domicilio: Middlesex, Inglaterra.

IDENTIFICACION

C.C.

☐

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Número _____

③

**REPRESENTANTE
O APODERADO**

Nombre: **ALICIA LLOREDA RICAURTE**

Dirección: Calle 72 No. 5-83 5° Piso

Teléfono: 3 264270 Fax: 6 069701

E-mail: jllcco@lloredacamacho.com

IDENTIFICACION

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Número 39.690.713 TP 53.215

④

Número de expediente:

06-094.721

⑤

Descripción de la corrección o modificación solicitada modificaciones voluntarias al Capítulo Reivindicatorio presentado en Fase Internacional.

⑥

Comprobante de pago No. 07-74,048

Fecha 13 de Septiembre de 2007

⑦

Anexos:

☒

Comprobante de pago de la tasa.

☐

Poderes, si fuere el caso.

☐

Certificado de existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.

⑧

NOMBRE ALICIA LLOREDA RICAURTE

FIRMA



C.C. 39.690.713 T.P. 53.215

279

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-094721- -00003-0000

Fecha: 2007-09-19 16:51:19 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 17

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 74,048
FECHA : SEPTIEMBRE 13 DE 2007

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
LLOREDA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	47999528	13/09/2007	3,960,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LEMAS COMERCIALES	99,000.00
		TOTAL :	\$ 99,000.00

SON: NOVENTA Y NUEVE MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

720
222

REIVINDICACIONES

1. 4-[[1-(aminocarbonil)-4-piperidinil]amino}-N-[(3,4-dimetilfenil)metil]-1-etil-1H-pirazolo[3,4-b]piridin-5-carboxamida o una sal de la misma.

2. 4-[[1-(aminocarbonil)-4-piperidinil]amino}-N-[(3,4-dimetilfenil)metil]-1-etil-1H-pirazolo[3,4-b]piridin-5-carboxamida o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma.

10

3. 4-[[1-(aminocarbonil)-4-piperidinil]amino}-N-[(3,4-dimetilfenil)metil]-1-etil-1H-pirazolo[3,4-b]piridin-5-carboxamida.

4. Un compuesto o una sal como se reivindicó en la reivindicación 2, en donde la sal farmacéuticamente aceptable incluye una sal de adición de ácido farmacéuticamente aceptable.

5. Un compuesto o sal como se reivindicó en la reivindicación 2, en donde la sal farmacéuticamente aceptable es una sal de adición de ácido farmacéuticamente aceptable.

6. Un compuesto o sal como se reivindicó en la reivindicación 4 ó 5, en donde la sal de adición de ácido farmacéuticamente aceptable ha sido formada por la combinación de 4-[[1-(aminocarbonil)-4-piperidinil]amino}-N-[(3,4-dimetilfenil)metil]-1-etil-1H-pirazolo[3,4-

Cláusulas independientes 1, 2 y 3

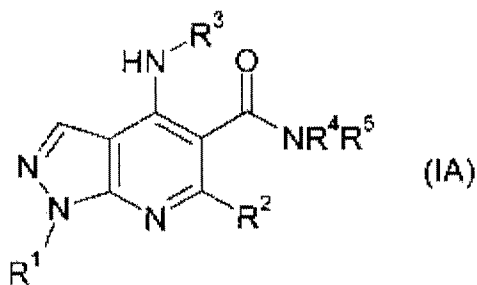
281
381

b]piridin-5-carboxamida con un ácido farmacéuticamente aceptable que tiene un pKa de 1.5 o menos.

- 5 7. Un compuesto o sal como se reivindicó en la reivindicación 4 6 5, en donde la sal de adición de ácido farmacéuticamente aceptable de la 4-[[1-(aminocarbonil)-4-piperidinil]amino}-N-[(3,4-dimetilfenil)metil]-1-etil-1H-pirazolo[3,4-b]piridin-5-carboxamida comprende una sal de bromhidrato, clorhidrato, sulfato, nitrato, fosfato, p-toluensulfonato, bencenosulfonato, metanosulfonato, etanosulfonato, o 10 naftalenosulfonato de la misma.

- 8 Clorhidrato de 4-[[1-(aminocarbonil)-4-piperidinil]amino}-N-[(3,4-dimetilfenil)metil]-1-etil-1H-pirazolo[3,4-b]piridin-5-carboxamida.

- 15 9. Un método para preparar un compuesto de formula (IA) o una sal del mismo:



en donde:

25

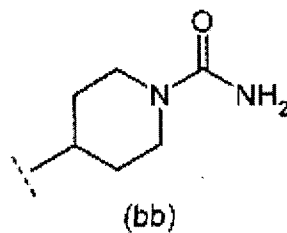
287
282

R^1 es etilo;

R^2 es un átomo de hidrógeno (H);

R^3 es un grupo N-aminocarbonil-piperidinilo de sub-formula (bb) que no está sustituido en un carbono de anillo:

5



10

R^4 es un átomo de hidrógeno (H);

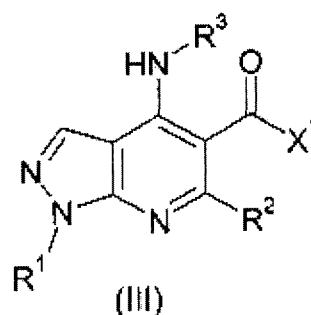
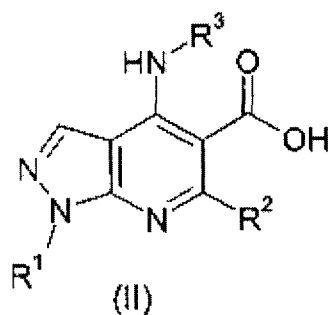
y R^5 es (3,4-dimetilfenil)metilo;

en donde el método comprende:

15

(a) convertir un compuesto de formula (II) en un compuesto activado de formula (III) en donde X^1 = un grupo saliente sustituible por una amina:

20



25

284
284

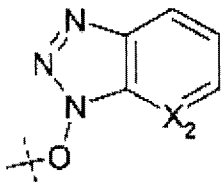
con un reactivo formador de urea capaz de convertir el grupo (4-piperidinil)amino del compuesto de formula (X) a un grupo [(1-aminocarbonil)-4-piperidinil]amino;

- 5 y, en el caso de (a), (b) o (c), convertir opcionalmente el compuesto de formula (I) en una sal del mismo; o

- (g) $\rightarrow ?$ d) en un método para preparar una sal farmacéuticamente aceptable del compuesto de formula (I), convertir el compuesto de formula (I) o
10 una sal del mismo en la sal farmacéuticamente deseada del mismo.

10. Un método como se reivindicó en la reivindicación 9, en donde el compuesto activado de formula (III) es el cloruro ácido, o el compuesto activado de formula (III) es un éster activado, en donde el grupo saliente

15

X¹ esX₂ = CH o N

20

11. Un método como se reivindicó en la reivindicación 9 o 10, en donde, en la formula (VIIA), Hal es un átomo de bromo o un átomo de cloro.

25

285
235

12. Un método como se reivindicó en la reivindicación 9, 10 u 11, en donde en el paso (c), el reactivo formador de urea es trimetilsilil isocianato.

uso

5 13. 4-[[1-(aminocarbonil)-4-piperidinil]amino]-N-[(3,4-dimetilfenil)metil]-1-etil-1H-pirazolo[3,4-b]piridin-5-carboxamida o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma para uso como una sustancia activa terapéutica en un mamífero tal como un humano.

10 14. Un compuesto o sal como se reivindicó en la reivindicación 13, para uso en el tratamiento y/o profilaxis de una enfermedad inflamatoria y/o alérgica en un mamífero.

15 15. Un compuesto o sal como se reivindicó en la reivindicación 14, en donde el mamífero es un humano.

16. Un compuesto o sal como se reivindicó en la reivindicación 13, para uso en el tratamiento y/o profilaxis de dermatitis atópica en un humano.

20

17. Un compuesto o sal como se reivindicó en la reivindicación 13, para uso por administración tópica externa en el tratamiento y/o profilaxis de dermatitis atópica en un humano.

25

286
200

18. Una composición farmacéutica que comprende 4-[[1-(aminocarbonil)-4-piperidinil]amino}-N-[(3,4-dimetilfenil)metil]-1-etil-1H-pirazolo[3,4-b]piridin-5-carboxamida o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma, y uno o más vehículos y/o excipientes farmacéuticamente aceptables.

19. Una composición farmacéutica como se reivindicó en la reivindicación 18, que es adecuada para administración tópica externa a un humano.

10

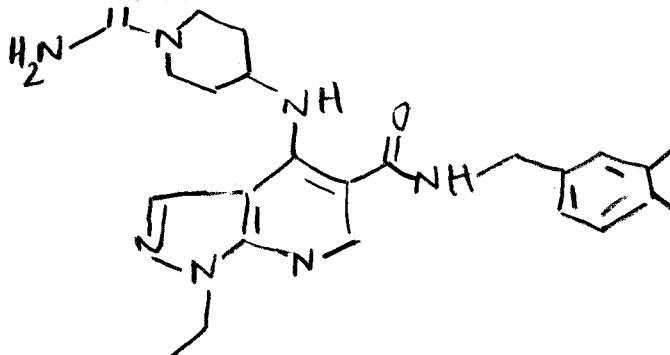
20. Una composición farmacéutica como se reivindicó en la reivindicación 19, que es adecuada para administración tópica a la piel de un humano.

21. Una composición farmacéutica como se reivindicó en la reivindicación 19 ó 20, en donde la 4-[[1-(aminocarbonil)-4-piperidinil]amino}-N-[(3,4-dimetilfenil)metil]-1-etil-1H-pirazolo[3,4-b]piridin-5-carboxamida o la sal farmacéuticamente aceptable de la misma está presente en 0.1% a 5% en peso de la composición (p/p).

20

22. Una composición farmacéutica como se reivindicó en la reivindicación 21, en donde la 4-[[1-(aminocarbonil)-4-piperidinil]amino}-N-[(3,4-dimetilfenil)metil]-1-etil-1H-pirazolo[3,4-b]piridin-5-carboxamida o la sal farmacéuticamente aceptable de la misma está presente en 0.2% a 3% en peso de la composición (p/p).

25



207
297

23. Una composición farmacéutica como se reivindicó en la reivindicación 19, 20, 21 o 22, que es un ungüento que contiene una fase oleosa (base de ungüento oleosa), en donde la fase oleosa comprende un aceite y/o una grasa.

5

24. Una composición farmacéutica como se reivindicó en la reivindicación 23, en donde la fase oleosa comprende un aceite que contiene o es parafina blanda blanca (vaselina blanca).

10

25. Una composición farmacéutica como se reivindicó en la reivindicación 22, que es un ungüento que contiene una fase oleosa (base de ungüento oleosa), en donde la fase oleosa comprende un aceite que contiene o es parafina blanda blanca (vaselina blanca).

15

26. Una composición farmacéutica como se reivindicó en la reivindicación 23, 24 o 25, en donde la fase oleosa (base de ungüento oleosa) está presente en 50 a 85% p/p del ungüento.

20

27. Una composición farmacéutica como se reivindicó en la reivindicación (19), 20, 22, 23, 24 o 25, que es un ungüento que comprende:

25

- 4-[[1-(aminocarbonil)-4-piperidinil]amino}-N-[(3,4-dimetilfenil)metil]-1-etil-1H-pirazolo[3,4-b]piridin-5-carboxamida o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma presente a 0.1% a 3% p/p;

298
298

- una fase oleosa (base de ungüento oleosa) presente en 25% a 99% p/p;

- uno o mas tensioactivos presentes en total en 0.5% a 10% p/p; y

5

- uno o más agentes que actúan como un mejorador de penetración de la piel presente en total en 0.5% a 50% p/p.

28. Una composición farmacéutica como se reivindicó en la reivindicación 27, que es un ungüento que comprende:

10

- 4-[[1-(aminocarbonil)-4-piperidinil]amino]-N-[(3,4-dimetilfenil)metil]-1-etil-1H-pirazolo[3,4-b]piridin-5-carboxamida o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma presente a 0.2% a 1.5% p/p;

15

- una fase oleosa (base de ungüento oleosa) presente en 50% a 80% p/p, y que comprende vaselina blanca presente en 45% a 75% p/p, y que también comprende aceite mineral presente en 2.5% a 15% p/p;

20

- uno o mas tensioactivos presentes en total en 3% a 10% p/p; y

- uno o más agentes hidrofílicos que actúan como solubilizantes y como mejoradores de penetración de la piel presentes en total en 5% a 50% p/p;

25

289

en donde, en la composición de ungüento, la fase oleosa (base de ungüento oleosa) y la fase de solubilizante hidrofílico/mejorador de penetración han sido emulsificadas para formar una emulsión de ungüento.

5

29. Una composición farmacéutica como se reivindicó en la reivindicación 19, 20 ó 22 que es una crema agua-en-aceite que comprende:

10 - 4-[[1-(aminocarbonil)-4-piperidinil]amino]-N-[(3,4-dimetilfenil)metil]-1-etil-1H-pirazolo[3,4-b]piridin-5-carboxamida o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma presente a 0.1% a 3% p/p;

15 - una fase oleosa (base de ungüento oleosa) presente en 25% a 85% p/p;

- agua presente en 2% a 30% p/p;

- uno o mas surfactantes presentes en total en 0.5% a 12% p/p; y

20

- uno o más agentes que actúan como un mejorador de penetración de la piel presente en total en 0.5% a 50% p/p.

25

740
790

30. Una composición farmacéutica como se reivindicó en la reivindicación (29) que es una emulsión en crema agua-en-aceite que comprende:

5 - 4-[[1-(aminocarbonil)-4-piperidinil]amino]-N-[(3,4-dimetilfenil)metil]-1-etil-1H-pirazolo[3,4-b]piridin-5-carboxamida o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma presente a 0.2% a 1.5% p/p;

- una fase oleosa (base de ungüento oleosa) presente en 35% a 70%
10 p/p, y que comprende vaselina blanca presente en 30% a 65% p/p, y que también comprende aceite mineral presente en 2.5% a 15% p/p;

- uno o mas tensioactivos presentes en total en 3% a 10% p/p; y

15 - uno o más agentes hidrofílicos que actúan como solubilizantes y como mejoradores de penetración de la piel presentes en total en 5% a 50% p/p.

31. Una composición farmacéutica como se reivindicó en la
20 reivindicación 19, 20 ó 22, que es una crema aceite-en-agua que comprende:

- 4-[[1-(aminocarbonil)-4-piperidinil]amino]-N-[(3,4-dimetilfenil)metil]-1-etil-1H-pirazolo[3,4-b]piridin-5-carboxamida o una sal farmacéuticamente
25 aceptable de la misma presente a 0.1% a 3% p/p;

291
291

- una fase oleosa (base de ungüento oleosa) que contiene uno o más ingredientes capaces de actuar como emolientes, la fase oleosa está presente en 20% a 60% p/p;

5 - agua presente en 15% a 75% p/p;

- uno o mas tensioactivos presentes en total en 0.5% a 12% p/p; y

10 - uno o más agentes que actúan como un mejoradores de penetración de la piel presente en total en 0.5% a 50% p/p.

32. Una composición farmacéutica como se reivindicó en la reivindicación 31, que es una emulsión en crema aceite-en-agua que comprende:

15

- 4-[[1-(aminocarbonil)-4-piperidinil]amino]-N-[(3,4-dimetilfenil)metil]-1-etil-1H-pirazolo[3,4-b]piridin-5-carboxamida o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma presente a 0.2% a 3% p/p;

20 - una fase oleosa (base de ungüento oleosa) que contiene uno o más ingredientes capaces de actuar como emolientes, la fase oleosa está presente en 30% a 55% p/p;

- agua presente en 15% a 50% p/p;

25

293

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Folio 293

2020
Bogotá D.C.,

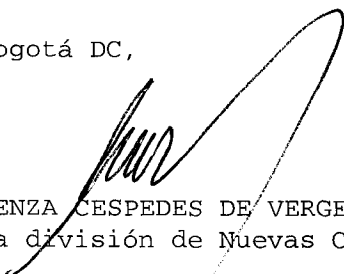
Doctor(a)
LLOREDA RICAURTE ALICIA
Apoderado(a) y/o Representante de
GLAXO GROUP LIMITED

REFERENCIA	Radicación No.	06 94721
	Solicitud internacional	PCT/EP2005/003038
	Fecha inicio fase nacional	16/10/2006
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	416
	Oficio No.	4186
	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.

09 OCT 2007

Cúmplase
Dado en Bogotá DC,


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

adpa10