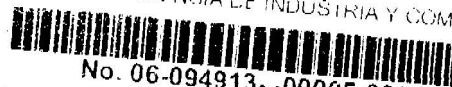


Señores
 SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
 DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. S. D.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-094913-00005-0000

Fecha: 2020-12-15 15:30:25 - Dep. 2020 NUEV. CREACIONES
 No. 06-094913-00005-0000 - Dep. 2020 NUEV. CREACIONES
 No. 06-094913-00005-0000 - Dep. 2020 NUEV. CREACIONES

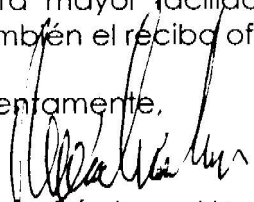
Ref.: Expediente No. 06094913
 Solicitud de patente INHIBIDORES DE GSK-3.
 Solicitante: NEUROPHARMA S.A.

Darío Cárdenas Navas, identificado como aparece al pie de mi firma, atentamente me dirijo a ese Despacho para aportar las siguientes modificaciones de forma a la descripción de la patente en referencia, las correcciones específicas son las siguientes:

- En página 6, el significado dado al término "aralquilo" es obviamente erróneo ya que corresponde de manera obvia a la definición de un radical "ácilo". Para subsanar este error se ha reemplazado el término "aralquilo" por "acilo".
- En página 10 de la descripción, las estructuras de los radicales difenilmetilo y 2-terbutil-6-metil fenilo presentando un error obvio relacionado con las valencias del átomo de carbono fueron corregidas.
- En página 24 de la descripción, las estructuras de los radicales difenilmetilo, 2-terbutil-6-metil fenilo y adamantilo fueron igualmente corregidas.
- En página 29, reivindicación 6, las estructuras de los radicales difenilmetilo y 2-terbutil-6-metil fenilo también fueron corregidas según se menciona en el apartado anterior.
- En página 30, la reivindicación original 10, incluyendo nueve estructuras específicas, fue dividida en nueve reivindicaciones, una para cada compuesto dando lugar a las nuevas reivindicaciones 10 a 18.
- Las reivindicaciones 11 a 22 fueron reenumeradas 19-30.

Para mayor facilidad adjunto nuevo capítulo descriptivo corregido, así como también el recibo oficial de modificación No 08-95.562

Atentamente,

Darío Cárdenas Navas 
 c.c. 17.066.629 de Bogotá
 t.p. 1.250
 JAG/amg
 F. P-383

2856

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-094913--00005-0000

DEPARTAMENTO DE INDUSTRIA Y COMERCIO
UNIDAD ADMINISTRATIVA ESPECIAL DE INDUSTRIA Y COMERCIO
AV. CALI 100 N° 100-100, CALI, VALLE DEL CAUCA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 95,562
FECHA : DICIEMBRE 10 DE 2008

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CARDENAS Y CARDENAS P.I.	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	10215520	10/12/2008	4,175,400.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LEYAS COMERCIALES	103,000.00
		TOTAL :	\$ 103,000.00

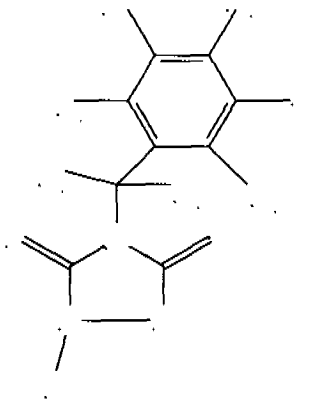
SON: CIENTO TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

CLAIMS

1. Un compuesto de fórmula general (I)

**Fórmula I**

en la cual:

R₁ es un grupo orgánico con al menos 8 átomos seleccionados de C u O, el cual no está enlazado directamente al N a través de un -C(O)- y el cual comprende al menos un anillo aromático;

10 R_a, R_b, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆ se seleccionan independientemente entre hidrógeno, alquilo sustituido o no sustituido, cicloalquilo sustituido o no sustituido, alquenilo sustituido o no sustituido, arilo sustituido o no sustituido, heterociclilo sustituido o no sustituido, -COR₇, -C(O)OR₇, -C(O)NR₇R₈, -C=NR₇, -CN, -OR₇, -OC(O)R₇, -S(O)_t-R₇, -NR₇R₈, -NR₇C(O)R₈, -NO₂, -N=CR₇R₈ o halógeno,

15 donde R_a y R_b juntos pueden formar un grupo =O, y donde cualquier par R_aR₂, R₂R₃, R₃R₄, R₄R₅, R₅R₆, R₆R₇ o R₇R₈ pueden formar juntos un sustituyente cíclico; t es 0, 1, 2 ó 3,

R₇ y R₈ son seleccionados independientemente cada uno de hidrógeno, alquilo sustituido o no sustituido, cicloalquilo sustituido o no sustituido, alquenilo sustituido o no sustituido, arilo sustituido o no sustituido, heterociclilo sustituido o no sustituido, alcoxi sustituido o no sustituido, ariloxi sustituido o no sustituido, halógeno;

20 o una sal farmacéuticamente aceptable, prodroga o solvato del mismo.

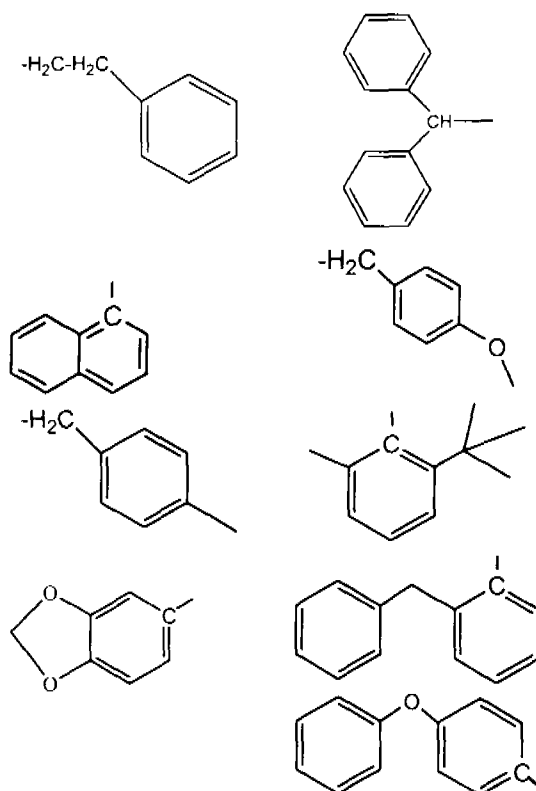
2. Un compuesto según la reivindicación 1 donde R_1 tiene al menos 10 carbonos aromáticos.

3. Un compuesto según las reivindicaciones 1 o 2, donde el grupo aromático está directamente enlazado al N de la tiadiazolidina.

5 4. Un compuesto según la reivindicación 3 donde R_1 es un grupo naftilo sustituido o no sustituido.

5. Un compuesto según la reivindicación 4 donde R_1 es un grupo alfa-naftilo sustituido o no sustituido, preferentemente un grupo naftilo no sustituido.

10 6. Un compuesto según la reivindicación 1 donde R_1 es un grupo seleccionado de entre:

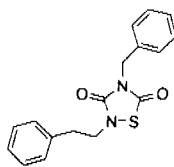


7. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1-6 donde tanto R_a como R_b son H.

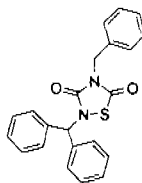
15 8. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1-7 donde R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , R_6 son independientemente seleccionados de hidrógeno, alquilo sustituido o no sustituido, $-COR_7$, $-C(O)OR_7$, $-OR_7$, $-NR_7R_8$, o halógeno, donde R_7 y R_8 son como definidos en la reivindicación 1.

9. Un compuesto según la reivindicación 8, donde R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , R_6 son H.

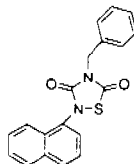
10. Un compuesto según la reivindicación 1 que tiene la fórmula:



11. Un compuesto según la reivindicación 1 que tiene la fórmula:

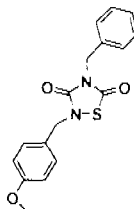


12. Un compuesto según la reivindicación 1 que tiene la fórmula:

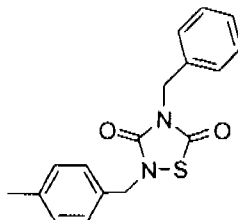


5

13. Un compuesto según la reivindicación 1 que tiene la fórmula:

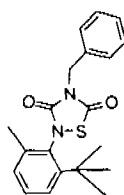


14. Un compuesto según la reivindicación 1 que tiene la fórmula:

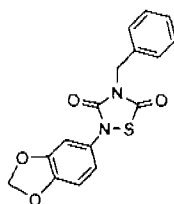


10

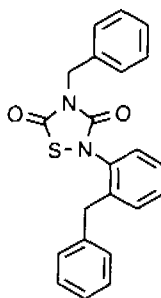
15. Un compuesto según la reivindicación 1 que tiene la fórmula:



16. Un compuesto según la reivindicación 1 que tiene la fórmula:

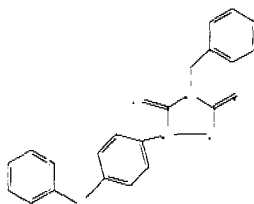


17. Un compuesto según la reivindicación 1 que tiene la fórmula:

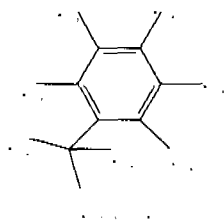


5

18. Un compuesto según la reivindicación 1 que tiene la fórmula:

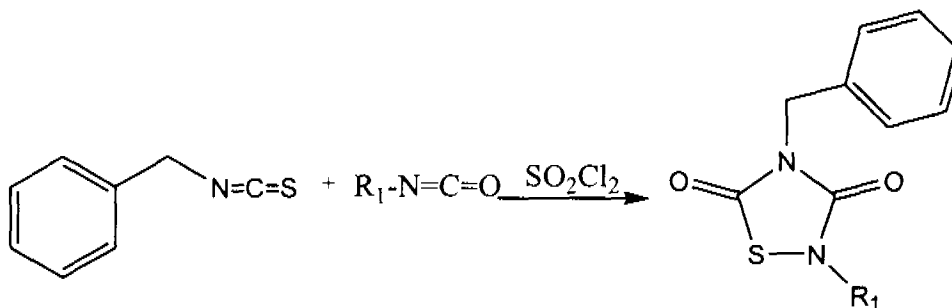


10 19. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula (I) o una sal o solvato del mismo como reivindicado en cualquiera de las reivindicaciones 1-18, que comprende reaccionar un isotiocianato sustituido con bencilo de formula II

**Fórmula II**

con un compuesto de fórmula $R_1-N=C=O$.

- 5 20. Un procedimiento según la reivindicación 19 que comprende la reacción:



donde R_1 es como definido en la reivindicación 1, preferentemente como definido en la reivindicación 6.

- 10 21. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto como reivindicado en cualquiera de las reivindicaciones 1-18 o una sal farmacéuticamente aceptable, prodroga o solvato del mismo y un excipiente, adyuvante o vehículo farmacéuticamente aceptable.

- 15 22. Una composición farmacéutica según la reivindicación 21 para administración oral.

23. Uso de un compuesto como definido en cualquiera de las reivindicaciones 1-18 en la preparación de un medicamento.

24. Uso según la reivindicación 23 donde el medicamento es para el tratamiento de una enfermedad o condición mediada por GSK-3.

- 20 25. Uso según la reivindicación 24 donde la enfermedad o condición es diabetes, condiciones asociadas con diabetes, condiciones neurodegenerativas crónicas incluyendo demencias tales como Enfermedad de Alzheimer, Enfermedad de Parkinson, Parálisis supranuclear progresiva, panencefalitis esclerosante subaguda, parkinsonismo postencefalítico, encefalitis pugilística, complejo parkinsonismo-demencia de Guam,
- 25 Enfermedad de Pick, degeneración corticobasal, demencia frontotemporal, Enfermedad

62

de Huntington, demencia asociada a SIDA, esclerosis amiotrófica lateral, esclerosis múltiple o enfermedades neurotraumáticas tales como apoplejía aguda, epilepsia, desorden del estado anímico, tales como depresión, esquizofrenia y desórdenes bipolares, promoción de la recuperación funcional post-apoplejía, hemorragia cerebral, tal como la causada por una angiopatía amiloide cerebral, pérdida del cabello, obesidad, enfermedad cardiovascular aterosclerótica, hipertensión, síndrome del ovario poliquístico, síndrome X, isquemia, daño cerebral, especialmente daño cerebral traumático, cáncer, leucopenia, Síndrome de Down, Enfermedad de Cuerpos de Lewy, inflamación, enfermedades inflamatorias crónicas, cáncer y enfermedades hiperproliferativas tales como hiperplasias e inmunodeficiencia.

26. Uso según la reivindicación 25 donde la enfermedad es la enfermedad de Alzheimer.

27. Uso según la reivindicación 25 donde la enfermedad es diabetes de tipo II.

15 28. Uso según la reivindicación 25 donde la enfermedad es depresión.

29. Uso según la reivindicación 25 donde la enfermedad es daño cerebral.

30. Uso de compuestos de fórmula (I) como definido en cualquiera de las reivindicaciones 1-18 como reactivos para ensayos biológicos, preferentemente como reactivos para la inhibición de GSK-3.

20

8