

Rad: 08-094913-00003-0000
 Rec: 2006-01-15 10:48:34 USP. 2006 NUEVAS CREACIONES
 118 11 PATENTE/ITR
 EVS: J16 PASSENAJUALI
 ACT 444 RESPUUESTA/QUE 10005: /

Señores
 Superintendencia de Industria y Comercio
 División de Nuevas Creaciones
 E. S. D.

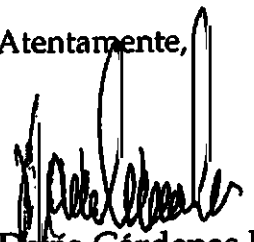
Ref: Expediente No. 06-094.913
 Proceso de registro de la patente PCT INHIBIDORES DE
 GSK-3
 Solicitante: Neuropharma S.A.

Darío Cárdenas Navas, identificado como aparece al pie de mi firma y obrando en mi condición de apoderado de la sociedad Neuropharma S.A., solicitante de la patente PCT mencionada en la referencia, en respuesta al Oficio No. 14709 notificado el 22 de Diciembre de 2.006 me permito informar al Despacho que mediante memorial radicado dentro de este expediente el día 21 de Diciembre de 2.006 adjunté Poder otorgado por la sociedad Neuropharma S.A. así como el documento de traspaso debidamente firmado y Apostillado, adjunto para su rápida referencia una copia radicada del mencionado memorial.

Como complemento a la radicación mencionada, adjunto el capítulo reivindicatorio, correspondiente.

Solicito a ese despacho proceder con la publicación de la patente en referencia.

Atentamente,

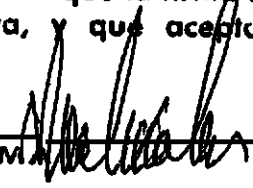


Darío Cárdenas Navas
 C.C. 17.066.629 de Bogotá OK
 T. P. 1.250 del Consejo Superior de la Judicatura

JAG/amg
 Fol P-383

COMPARECENCIA PERSONAL Y AUTENTICACION DE FIRMA
 El Notario Dieciséis (16) (E) de Bogotá, da fé que el anterior escrito dirigido a: Superintendencia de Industria y Comercio fue presentado personalmente por: Darío Cárdenas Navas quien exhibió la C.C. No. 17066629 de Bogotá y T.P. No. 1250 y manifestó que la firma que aparece en el presente documento es suya, y que acepta el contenido del mismo.



FIRMA 

JHON JAIRO MARTINEZ GONZALEZ
 NOTARIO 16 ENCARGADO

15 ENE. 2007

Señores
Superintendencia de Industria y Comercio
División de Nuevas Creaciones
E. S. D.

46
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 06-094913- -00002-0000
ec: 2006-12-21 16:03:15 Dep. 2020 NUECREACIONES
Ta. 11 PATENTE/IN
No 376 FASENACIONAL
del 329 CTOINFORMACION For03: 9

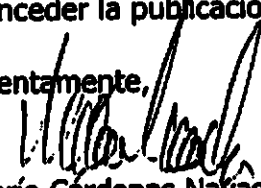
Ref.: Expediente No. 06-094.913.
Fase Nacional para la solicitud de Patente PCT titulada
"INHIBIDORES DE GSK-3"
Titular: Neuropharma S.A.

Dario Cárdenas Navas, identificado como aparece al pie de mi firma,
atentamente me dirijo a ese Despacho adjuntando los siguientes documentos:

1. Poder otorgado por la sociedad Neuropharma S.A., debidamente firmado ante Notario y Apostillado donde consta igualmente la Existencia y Representación Legal del Solicitante.
2. Documento de Traspaso debidamente firmado ante Notario y Apostillado.

Habiendo cumplido las formalidades de ley solicito a ese Despacho proceda a conceder la publicación de la solicitud en referencia.

Atentamente,

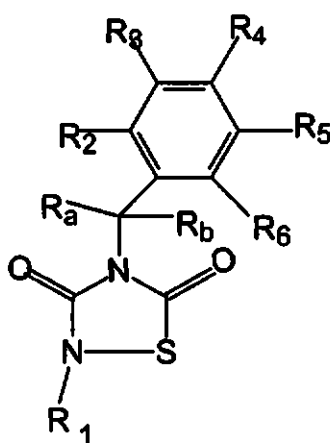

Dario Cárdenas Navas
c.c. 17.066.629 de Bogotá
t.p. 1.250 c.s.j. L1

jag/correspondencia.neuropharma.inhibidoresdegsk-3

NOTARIA 16 DEL CIRCULO DE
BOGOTÁ, D.C.
DILIGENCIA DE PRESENTACION PERSONAL
Y RECONOCIMIENTO
El Notario (E) hace constar que el escrito que
antecede fué presentado personalmente por
Dario Cárdenas Navas
17.066.629
identificado con c.c. 17.066.629
con que su contenido
las firmas pue 17.066.629
BOGOTÁ, D.C. 2006-12-21
JHON JAIRO MARTINEZ GONZALEZ
NOTARIO 16 ENCARGADO

CLAIMS

1. Un compuesto de fórmula general (I)

**Fórmula I**

en la cual:

R_1 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;

R_a , R_b , R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , R_6 se seleccionan independientemente entre hidrógeno, alquilo sustituido o no sustituido, cicloalquilo sustituido o no sustituido, alqueno sustituido o no sustituido, arilo sustituido o no sustituido, heterociclilo sustituido o no sustituido, $-COR_7$, $-C(O)OR_7$, $-C(O)NR_7R_8$, $-C=NR_7$, $-CN$, $-OR_7$, $-OC(O)R_7$, $-S(O)_t-R_7$, $-NR_7R_8$, $-NR_7C(O)R_8$, $-NO_2$, $-N=CR_7R_8$ o halógeno,

donde R_a y R_b juntos pueden formar un grupo $=O$, y donde cualquier par R_4R_2 , R_2R_3 , R_3R_4 , R_4R_5 , R_5R_6 , R_6R_b o R_7R_8 pueden formar juntos un sustituyente cíclico;

t es 0, 1, 2 ó 3,

R_7 y R_8 son seleccionados independientemente cada uno de hidrógeno, alquilo sustituido o no sustituido, cicloalquilo sustituido o no sustituido, alqueno 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;

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

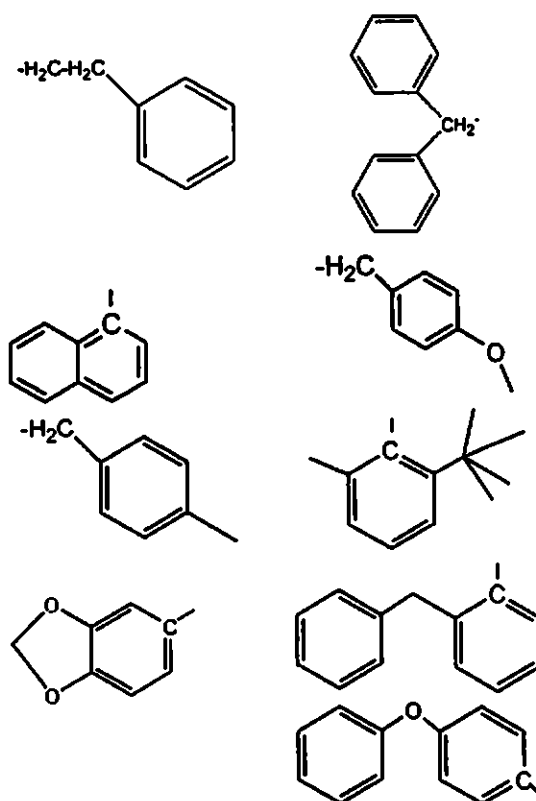
2. Un compuesto según la reivindicación 1 donde R_1 tiene al menos 10 carbonos aromáticos.

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:



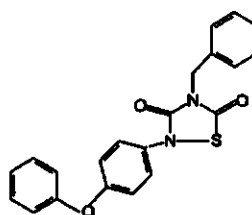
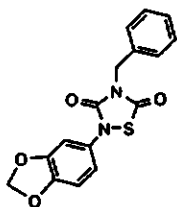
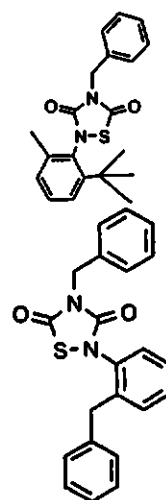
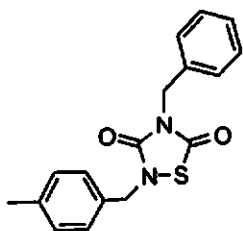
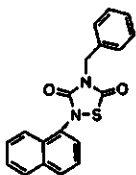
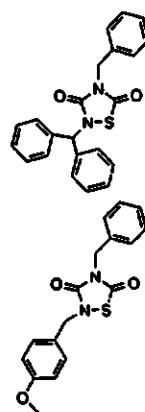
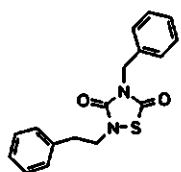
7. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1-6 donde tanto R_a como R_b son H.

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.

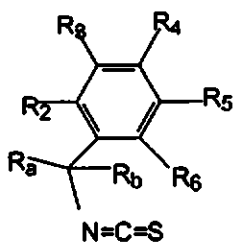
9. Un compuesto según la reivindicación 8, donde R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , R_6 son H.

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

30



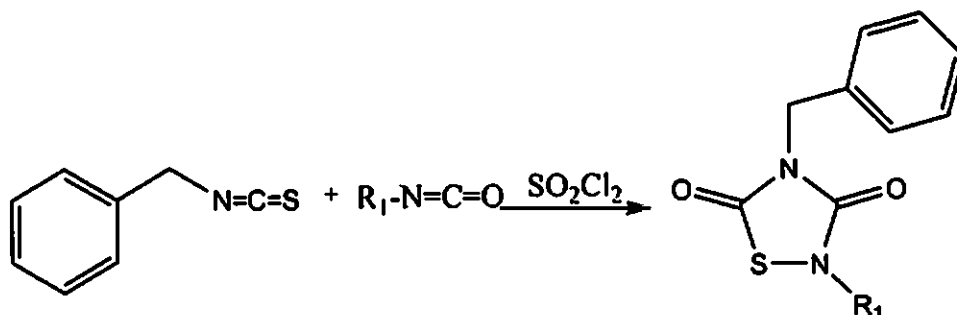
11. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula (I) o una sal o solvato del mismo como reivindicado en cualquiera de las reivindicaciones 1-10, que comprende reaccionar un isotiocianato sustituido con bencilo de formula II



Fórmula II

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

12. Un procedimiento según la reivindicación 11 que comprende la reacción:



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

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

14. Una composición farmacéutica según la reivindicación 13 para administración oral.

15. Uso de un compuesto como definido en cualquiera de las reivindicaciones 1-10 en la preparación de un medicamento.

16. Uso según la reivindicación 15 donde el medicamento es para el tratamiento de una enfermedad o condición mediada por GSK-3.

17. Uso según la reivindicación 16 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, Enfermedad de Pick, degeneración corticobasal, demencia frontotemporal, Enfermedad 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.

5 18. Uso según la reivindicación 17 donde la enfermedad es la enfermedad de Alzheimer.

 19. Uso según la reivindicación 17 donde la enfermedad es diabetes de tipo II.

 20. Uso según la reivindicación 17 donde la enfermedad es depresión.

10 21. Uso según la reivindicación 17 donde la enfermedad es daño cerebral.

 22. Uso de compuestos de fórmula (I) como definido en cualquiera de las reivindicaciones 1-10 como reactivos para ensayos biológicos, preferentemente como reactivos para la inhibición de GSK-3.