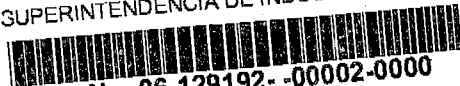


SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-129192-00002-0000

Fecha: 2007-09-19 16:51:47 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTE IYII Eje: 378 FASE NACIONAL I
Act. 329 C/O INFORMACION Folios: 9

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

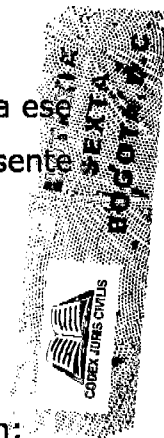
Re: P1.-THERAVENCE, INC.-Solicitud de Patente de Invención en Fase Nacional PCT para "AGONISTAS DEL RECEPTOR ADRENÉRGICO B₂ DE DIAMINA".-Clase C07C 215/00.-Expediente número 06-129.192.-

1. Me refiero a mi memorial radicado ante ese Despacho el 15 de Marzo de 2007.
2. Debidamente autorizado por mí representado, y siguiendo los lineamientos de la respuesta emitida por ese Despacho al Derecho de Petición cuyo numero 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 el 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. Anexos me permito presentar:

- (a) Recibo No. 07-74,065, que acredita el pago de la tasa de modificación;
- (b) Formulario único de modificaciones y correcciones;
- (c) Copia de capítulo reivindicatorio que reemplaza aquel presentado en fase internacional.



JOSE LLORED A CAMACHO & CO.

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 6069700 Fax 6069701

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

Señor Superintendente,


ALICIA LLORED A RICAURTE

T.P. 53.215

NOTARIA S E X T A DE BOGOT A

RECONOCIMIENTO Y PRESENTACION PERSONAL

Bogotá, D.C.

Ante mí JUAN MANUEL BOTERO MEDINA

NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOT A

Comparecieron: Alicia Lloreda Ricaurte

quien (as) exhibió(eron) la(s) C.C.

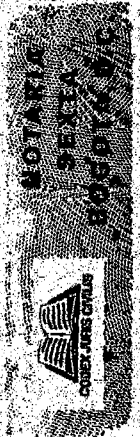
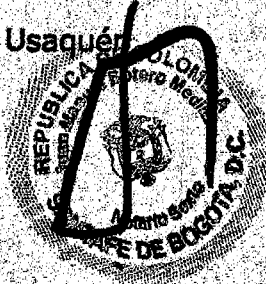
C.C. 39.690.713

T.P. 53.215

y declaró(aron) que la(s) 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 A RICAURTE

C.C. No. 39.690.713 de Usaquén

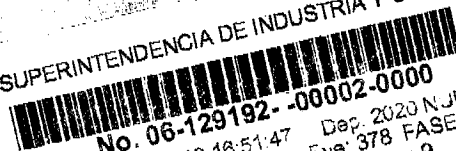


FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES.
2000-10

1		SOLICITUD DE:	
☐ Corrección de Error Material.		☒ Modificación a una Solicitud.	
2 SOLICITANTE	Nombre: THERAVANCE, INC. sociedad existente y organizada de conformidad con las leyes del Estado de Delaware, Estados Unidos de América. Dirección: 901 Gateway Boulevard, South San Francisco, CA 94080, Estados Unidos de América Teléfono: 3 264270 Fax: 6 069701 E-mail: jllcco@lloredacamacho.com Domicilio: San Francisco, Estado de California, Estados Unidos de América	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 _____ TP _____	
4 Número de expediente: <u>06-129.192</u>			
5 Descripción de la corrección o modificación solicitada <u>Modificaciones voluntarias al capítulo</u> <u>Reivindicatorio presentado en Fase Internacional.</u> _____ _____ _____ _____ _____ _____			
6 Comprobante de pago No. <u>07-74,065</u> Fecha <u>Septiembre 13 de 2007</u>			
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 <u>ALICIA LLOREDA RICAURTE</u> FIRMA <u></u> C.C. <u>39.690.713</u> 53.215			
Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página.			

770
170

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-129192-00002-0000

Fecha: 2007-09-19 16:51:47

Dep: 2020 N/RECREACION
Eve: 378 FASENACIONALI
Folios: 9

Tra 11 PATENTEIYI
Act 329 CTOINFORMACION

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

MIT : 890176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 74,065
1 SEPTIEMBRE 13 DE 2007

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PGO	VAL. PAGO
LLOREBA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	47999328	13/09/2007	3,960,000.00

***** CONCEPTO *****

Nº. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-03 CAMBIO DE NODALIDAD Y MODIFICA	12 MARCAS Y LEYAS COMERCIALES	99,000.00
	TOTAL :	99,000.00

SON: NOVENTA Y NUEVE MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

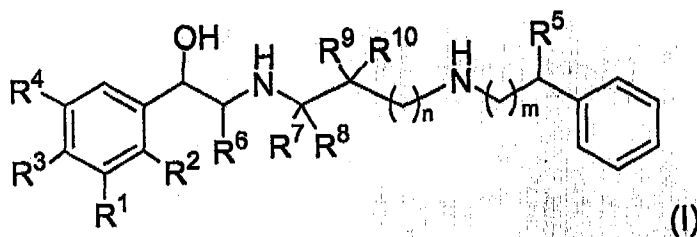
4

77
77

REIVINDICACIONES:

1. Un compuesto de formula (I):

5



en donde:

- 10 cada uno de R^1 , R^2 , R^3 , y R^4 se selecciona independientemente de hidrógeno, hidroxilo, amino, halo, $-CH_2OH$ y $-NHCHO$, o R^1 y R^2 tomados juntos se seleccionan de $-NHC(=O)CH=CH-$, $-CH=CHC(=O)NH-$, $-NHC(=O)S-$; y $-SC(=O)NH-$;

- 15 R^5 se selecciona de hidrógeno, $-OR^a$, y $-NR^aR^b$, en donde R^a y R^b son cada uno independientemente hidrógeno o alquilo C_{1-3} ;

n es un entero de 0 a 7;

m es un entero de 0 a 5; y

20

- 20 cada uno de R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , y R^{10} es independientemente hidrógeno o alquilo C_{1-6} ;

con la condición que cuando m es 0, R^5 es hidrógeno;

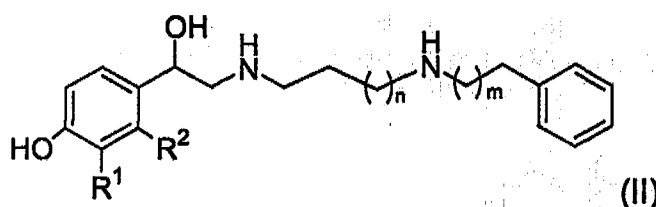
- 25 o una sal farmacéuticamente aceptable o solvato o estereoisómero del mismo.

2. El compuesto de la Reivindicación 1 en donde R^9 y R^{10} son cada uno hidrógeno.

30

3. El compuesto de la Reivindicación 1 o Reivindicación 2 en donde R^5 y R^6 son cada uno hidrógeno.

4. El compuesto de la Reivindicación 1 que es un compuesto de formula (II):



en donde:

R^1 es $-CH_2OH$ o $-NHCHO$, y R^2 es hidrógeno; o R^1 y R^2 tomados juntos son $-NHC(=O)CH=CH-$ o $-CH=CHC(=O)NH-$;

n es un entero de 2 a 6;

m es un entero de 0 a 3;

o una sal farmacéuticamente aceptable o solvato o estereoisómero del mismo.

5. El compuesto de la Reivindicación 4 en donde n es 4.

6. El compuesto de la Reivindicación 4 o Reivindicación 5 en donde m es 1.

7. El compuesto de cualquiera de las Reivindicaciones 4 a 6 en donde R^1 y R^2 tomados juntos son $-NHC(=O)CH=CH-$ o $-CH=CHC(=O)NH-$.

8. El compuesto de una cualquiera de las Reivindicaciones 4 a 7 en donde la estereoquímica en el carbono alqueno que porta el grupo hidroxilo es (*R*).

9. El compuesto de la Reivindicación 1 que tiene el nombre químico 8-hidroxi-5-[(*R*)-1-hidroxi-2-(6-fenetilamino-hexilamino)etil]-1*H*-quinolin-2-ona;

o una sal farmacéuticamente aceptable o solvato o estereoisómero del mismo.

10. Una composición farmacéutica que comprende una cantidad terapéuticamente efectiva del compuesto de una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 9 y un vehículo farmacéuticamente aceptable.

11. La composición farmacéutica de la Reivindicación 10, en donde la composición comprende además una cantidad terapéuticamente efectiva de uno o más de otros agentes terapéuticos.

12. La composición farmacéutica de la Reivindicación 11 en donde el otro agente terapéutico es un corticosteroide, un agente anticolinérgico, o un inhibidor de PDE4.

13. La composición farmacéutica de cualquiera de las Reivindicaciones 10 a 12, en donde la composición está formulada para administración por inhalación.

14. Una combinación que comprende el compuesto de una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 9 y uno o más de otros agentes terapéuticos.

15. Una combinación que comprende un compuesto de una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 9 y un compuesto seleccionado de propionato de fluticasona, S-fluorometil éster del ácido 6 α , 9 α -difluoro-11 β -hidroxi-16 α -metil-17 α -[(4-metil, 1,3-tiazol-5-carbonil)oxi]-3-oxo-androsta-1,4-dieno-17 β -carbotiólico y S-fluorometil éster del ácido 6 α ,9 α -difluoro-17 α -[(2-furanil carbonil)oxi]-11 β -hidroxi-16 α -metil-3-oxo-androsta-1,4-dieno-17 β -carbotiólico.

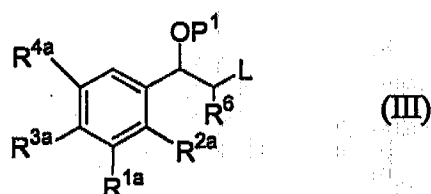
16. Un compuesto como se reivindicó en una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 9 para uso en terapia.

474

174

17. Un proceso para preparar un compuesto de formula (I) de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 9, el proceso comprende:

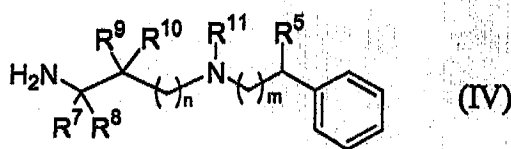
- 5 (a) la reacción de un compuesto de formula (III):



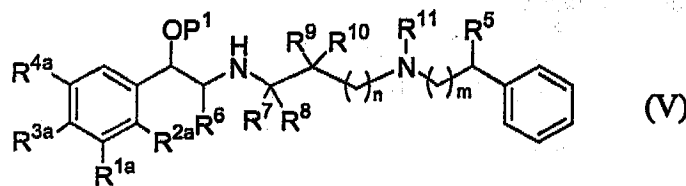
en donde:

- 10 P^1 es un grupo protector de hidroxí, L es un grupo saliente, cada uno de R^{1a} , R^{2a} , R^{3a} , y R^{4a} es independientemente ya sea igual a R^1 , R^2 , R^3 , y R^4 como se definió en una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 9 o es $-OP^2$, en donde P^2 es un grupo protector de hidroxí;

- 15 con un compuesto de formula (IV):



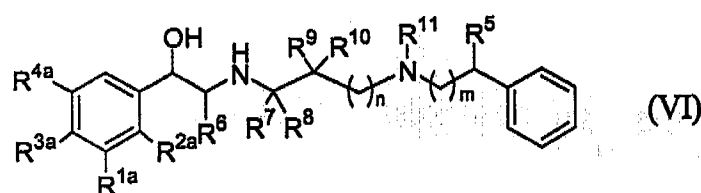
- en donde R^{11} es hidrógeno o P^3 en donde P^3 es un grupo protector de
20 amino, para dar un compuesto de formula (V):



- (b) remover el grupo protector P^1 para dar un compuesto de
25 formula (VI):

475

175



; y

- (c) cuando cualquiera de R^{1a} , R^{2a} , R^{3a} , o R^{4a} es $-OP^2$ o cuando R^{11} es P^3 , remover los grupos protectores P^2 y P^3 , si están presentes, para dar un compuesto de formula (I), o una sal o estereoisómero del mismo.

18. El producto preparado mediante el proceso de la Reivindicación 17.

176

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Folio 176

2020
Bogotá D.C.,

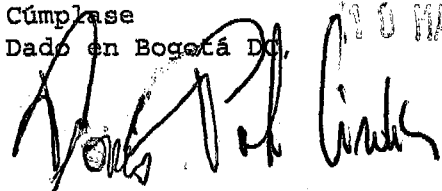
Doctor(a)
LLOREDA RICAURTE ALICIA
Apoderado(a) y/o Representante de
THERAVANCE, INC.

REFERENCIA	Radicación No.	06 129192
	Solicitud internacional	PCT/US2005
	Fecha inicio fase nacional	03/01/2007
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	416
	Oficio No.	7844
	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 D.C.

18 0 MAR. 2005


DORIS ELENA POLO CORDOBA
Jefe de la división de Nuevas Creaciones (E)

adpall

NO X