

LLOREDA & CIA. S. A.
ABOGADOS

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
jllico@lloredacamacho.com

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-053257- -00001-0000

Fecha: 2007-09-26 11:19:35 Dep: 2020 NUECREACION
Tra: 11 PATENTE, VII Eve: 379 FASE NACIONAL II
Act: 329 COTINFORMACION Folios: 13

Re: PI.-F. HOFFMANN-LA ROCHE AG.-Solicitud de Patente de Invención en Fase Nacional PCT para "DERIVADOS DE FENIL-PIPERAZINA-METANONA".-Clase C07D 277/82.-Expediente número 07-053.257.-

1. Me refiero a mi solicitud de patente de 28 de Mayo 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 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. Anexo me permito presentar:

- (a) Formulario único de correcciones y modificaciones;
- (b) Recibo número 07-77.015, expedido por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago de la modificación mencionada; y

LLOREDA & CIA. S. A.

(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 Lloreda Ricaurte

ALICIA LLOREDA RICAURTE

T.P. 53.215

RECONOCIMIENTO Y PRESENTACION PERSONAL

Bogota, D.C.

Ante mí PABLO MENDEZ BARAJAS

NOTARIO SEXTO (E) DEL CIRCULO DE BOGOTA

Comparecieron: *Alicia Lloreda Ricaurte*

Identificación: C.C. No. 39.690.713

39690713
53.215

y declara que el (los) 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 Lloreda Ricaurte
ALICIA LLOREDA RICAURTE

C.C. No. 39.690.713 de Usaquén

NOTARIA PABLO MENDEZ BARAJAS

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES.
2000-10

①

SOLICITUD DE:

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Solicitud.

②

SOLICITANTE

Nombre: **F. HOFFMANN-LA ROCHE AG**, sociedad existente y organizada de conformidad con las leyes de Suiza.

Dirección: Grenzacherstrasse 124 CH-4070 Basilea, Suiza.

Teléfono: 3 264270

Fax: 6069701

E-mail: jllcco@lloredacamacho.com

Domicilio: Basilea, Suiza.

IDENTIFICACION

C.C.

☐

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Número _____

③

**REPRESENTANTE
O APODERADO**

Nombre: ALICIA LLOREDA RICAURTE

Dirección: Calle 72 No. 5-83 5º 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:

07-053.257

⑤

Descripción de la corrección o modificación solicitada modificaciones voluntarias al capítulo reivindicatorio presentado en Fase Nacional.

⑥

Comprobante de pago No. 07-77.015

Fecha 24-09-07

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

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 77,015
FECHA : SEPTIEMBRE 24 DE 2007

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-053257- -00001-0000

Fecha: 2007-09-26 11:19:35 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tr. 11 PATENTE VII Eje. 379 FASE NACIONAL II
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 13

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
ARDA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	47999506	24/09/2007	2,772,000.00

***** CONCEPTO *****

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

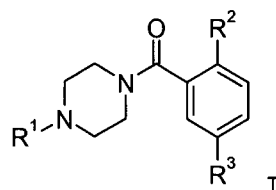
SON: NOVENTA Y NUEVE MIL PESOS

RESPONSABLE :

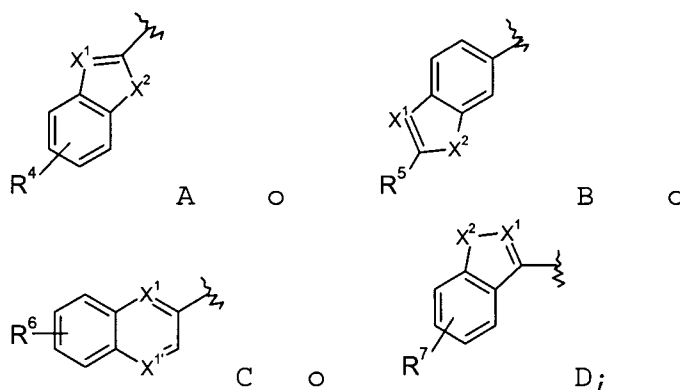
RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

REIVINDICACIONES

1. Compuestos de la fórmula general



5 en la que
R¹ es el grupo



10

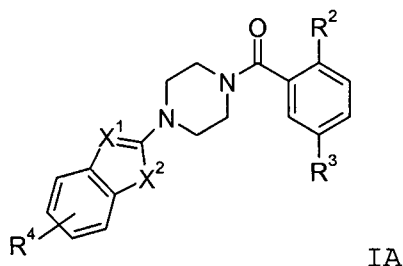
- R² es un heterociclo no aromático o es OR' o N(R'')₂;
R' es alquilo inferior, alquilo inferior sustituido por halógeno o -(CH₂)ₙ-cicloalquilo;
15 R'' es alquilo inferior;
R³ es NO₂, CN o SO₂R';
R⁴ es hidrógeno, hidroxí, halógeno, NO₂, alquilo inferior, alquilo inferior sustituido por halógeno, alcoxi inferior, SO₂R' o C(O)OR'';
20 R⁵/R⁶/R⁷ son hidrógeno, halógeno, alquilo inferior o alquilo inferior sustituido por halógeno;
X¹/X¹' son CH o N, con la condición de que X¹/X¹' no sean simultáneamente CH;

X^2 es O, S, NH o N(alquilo inferior);

n es 0, 1 ó 2;

y a sales de adición de ácido farmacéuticamente activas.

2. Compuesto de la fórmula IA según la reivindicación 1
5 cuando R^1 es A,



en la que

R^2 es un heterociclo no aromático o es OR' o $N(R'')_2$;

R' es alquilo inferior, alquilo inferior sustituido por
10 halógeno o $-(CH_2)_n$ -cicloalquilo;

R'' es alquilo inferior;

R^3 es NO_2 , CN o SO_2R' ;

R^4 es hidrógeno, hidroxilo, halógeno, NO_2 , alquilo inferior,
alquilo inferior sustituido por halógeno, alcoxi infe-
15 rior, SO_2R' o $C(O)OR''$;

X^1 es CH o N;

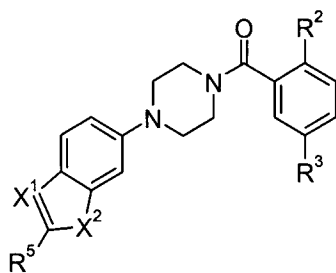
X^2 es O, S, NH o N(alquilo inferior);

n es 0, 1 ó 2;

y sales de adición de ácido farmacéuticamente activas.

20 3. El compuesto de la fórmula IB según la reivindi-
cación 1, cuando R^1 es B

- 62 -



IB

en la que

R^2 es un heterociclo no aromático o es OR' o $N(R'')_2$;

R' es alquilo inferior, alquilo inferior sustituido por
5 halógeno o $-(CH_2)_n$ -cicloalquilo;

R'' es alquilo inferior;

R^3 es NO_2 , CN o SO_2R' ;

R^5 es hidrógeno, halógeno, alquilo inferior o alquilo
inferior sustituido por halógeno;

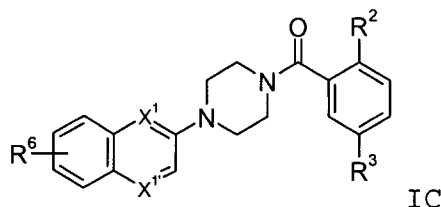
10 X^1 es CH o N ;

X^2 es O , S , NH o N (alquilo inferior);

n es 0, 1 ó 2;

y sales de adición de ácido farmacéuticamente activas.

4. El compuesto de la fórmula IC según la reivindi-
15 cación 1, cuando R^1 es C



IC

en la que

R^2 es un heterociclo no aromático o es OR' o $N(R'')_2$;

20 R' es alquilo inferior, alquilo inferior sustituido por
halógeno o $-(CH_2)_n$ -cicloalquilo;

R'' es alquilo inferior;

R^3 es NO_2 , CN o SO_2R' ;

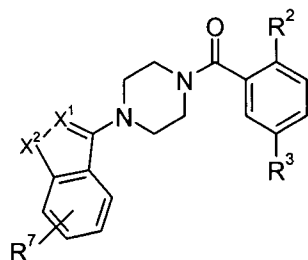
R^6 es hidrógeno, halógeno, alquilo inferior o alquilo inferior sustituido por halógeno;

$X^1/X^{1'}$ son CH o N , con la condición de que $X^1/X^{1'}$ no sean simultáneamente CH ;

n es 0, 1 ó 2;

y sales de adición de ácido farmacéuticamente activas.

5. El compuesto de la fórmula ID según la reivindicación 1, cuando R^1 es D



10

ID

en la que

R^2 es un heterociclo no aromático o es OR' o $N(R'')_2$;

R' es alquilo inferior, alquilo inferior sustituido por halógeno o $-(CH_2)_n$ -cicloalquilo;

R'' es alquilo inferior;

R^3 es NO_2 , CN o SO_2R' ;

R^7 es hidrógeno, halógeno, alquilo inferior o alquilo inferior sustituido por halógeno;

20 X^1 es CH o N ;

X^2 es O , S , NH o N (alquilo inferior);

n es 0, 1 ó 2;

y sales de adición de ácido farmacéuticamente activas.

6. Compuestos de la fórmula IA según la reivindicación 1, dichos compuestos son:

25

- [4-(6-cloro-benzotiazol-2-il)-piperazin-1-il]-(2-morfolin-4-il-5-nitro-fenil)-metanona,
- [4-(6-cloro-benzotiazol-2-il)-piperazin-1-il]-(2-isopropoxi-5-metanosulfonil-fenil)-metanona,
- 5 (4-benzooxazol-2-il-piperazin-1-il)-(2-ciclopentiloxi-5-metanosulfonil-fenil)-metanona,
- (4-benzooxazol-2-il-piperazin-1-il)-(2-isobutoxi-5-metanosulfonil-fenil)-metanona,
- (2-isopropoxi-5-metanosulfonil-fenil)-[4-(6-metoxi-benzotiazol-2-il)-piperazin-1-il]-metanona,
- 10 (2-isopropoxi-5-metanosulfonil-fenil)-[4-(6-nitro-benzotiazol-2-il)-piperazin-1-il]-metanona,
- (2-isopropoxi-5-metanosulfonil-fenil)-[4-(4-metoxi-benzotiazol-2-il)-piperazin-1-il]-metanona,
- 15 (2-isopropoxi-5-metanosulfonil-fenil)-[4-(4-nitro-benzotiazol-2-il)-piperazin-1-il]-metanona,
- [4-(4-hidroxi-benzotiazol-2-il)-piperazin-1-il]-(2-isopropoxi-5-metanosulfonil-fenil)-metanona,
- [4-(5-cloro-benzotiazol-2-il)-piperazin-1-il]-(2-isopropoxi-5-metanosulfonil-fenil)-metanona,
- 20 [4-(6-etoxi-benzotiazol-2-il)-piperazin-1-il]-(2-isopropoxi-5-metanosulfonil-fenil)-metanona,
- [4-(6-cloro-benzotiazol-2-il)-piperazin-1-il]-(2-ciclopropilmetoxi-5-metanosulfonil-fenil)-metanona o
- 25 [4-(6-cloro-benzotiazol-2-il)-piperazin-1-il]-[5-metanosulfonil-2-((S)-2,2,2-trifluor-1-metil-etoxi)-fenil]-metanona.

7. Compuestos de la fórmula IB según la reivindicación 3, dicho compuesto es la (2-isobutoxi-5-metanosulfonil-fenil) - [4-(2-metil-benzotiazol-5-il) - piperazin-1-il] - metanona.

8. Compuestos de la fórmula IC según la reivindicación 4, dichos compuestos son:
- (2-isobutoxi-5-metanosulfonil-fenil) - (4-quinolin-2-il-piperazin-1-il) - metanona,
- [4-(6-cloro-quinolin-2-il) - piperazin-1-il] - (2-ciclopentiloxi-5-metanosulfonil-fenil) - metanona,
- 10 (2-isobutoxi-5-metanosulfonil-fenil) - (4-quinoxalin-2-il-piperazin-1-il) - metanona,
- (2-isopropoxi-5-metanosulfonil-fenil) - (4-quinoxalin-2-il-piperazin-1-il) - metanona,
- (2-ciclopentiloxi-5-metanosulfonil-fenil) - (4-quinoxalin-2-il-
- 15 piperazin-1-il) - metanona,
- (2-isobutoxi-5-metanosulfonil-fenil) - (4-quinolin-3-il-piperazin-1-il) - metanona o
- (2-ciclopentiloxi-5-metanosulfonil-fenil) - (4-quinolin-3-il-piperazin-1-il) - metanona.

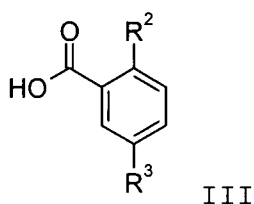
- 20 9. Compuestos de la fórmula ID según la reivindicación 5, dichos compuestos son:
- (4-benzo[d]isotiazol-3-il-piperazin-1-il) - (2-isopropoxi-5-metanosulfonil-fenil) - metanona,
- (4-benzo[d]isotiazol-3-il-piperazin-1-il) - (2-ciclopropil-
- 25 metoxi-5-metanosulfonil-fenil) - metanona o
- (4-benzo[d]isotiazol-3-il-piperazin-1-il) - [5-metanosulfonil-2-((S)-2,2,2-trifluor-1-metil-etoxi) - fenil] - metanona.

10. Un proceso de obtención de un compuesto de la fórmula I definido en la reivindicación 1, dicho proceso consiste en:

a) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula



con un compuesto de la fórmula

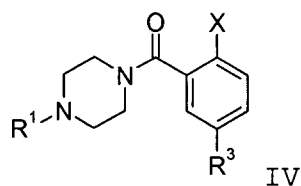


en presencia de un agente activante,
para obtener un compuesto de la fórmula



en la que los sustituyentes tienen los significados definidos en la reivindicación 1, o

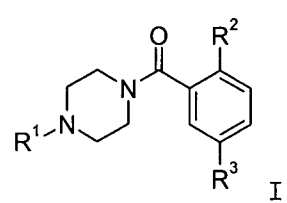
b) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula



15 con compuesto de la fórmula

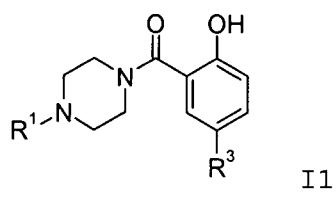


en presencia de una base o añadiendo un catalizador
para obtener un compuesto de la fórmula



en la que los sustituyentes R^1 , R^2 y R^3 tienen los significados definidos en la reivindicación 1 y X es halógeno, o

c) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula

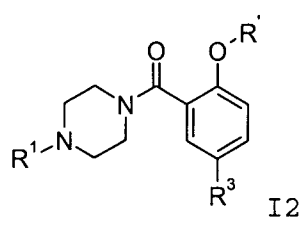


5

con un compuesto de la fórmula

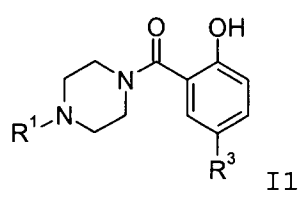


para obtener un compuesto de la fórmula



10 en la que los sustituyentes R^1 , R' y R^3 tienen los significados definidos en la reivindicación 1 y X es halógeno; o

d) hacer reaccionar compuesto de la fórmula

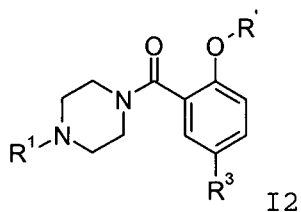


15 con un compuesto de la fórmula



en condiciones de Mitsunobu

para obtener un compuesto de la fórmula



en la que los sustituyentes R^1 , R' y R^3 tienen los significados definidos anteriormente,

5 y, si se desea, convertir los compuestos obtenidos en sales de adición de ácido farmacéuticamente aceptables.

11. Un medicamento que contiene uno o varios compuestos reivindicados en una cualquiera de las reivindicaciones 1 - 10 y excipientes farmacéuticamente
10 aceptables.