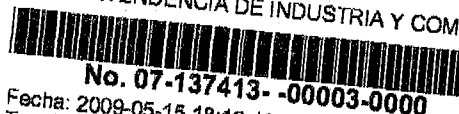


W0 2007 02559
Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

OLARTE RAISBECK
OLARTE RAISBECK N

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-137413-00003-0000
Fecha: 2009-05-15 18:12:13 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Evt. 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 9

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

P2007/000214

SOLICITUD DE:

1

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Solicitud.

2

SOLICITANTE
(71)

Nombre: GLAXO GROUP LIMITED

Dirección: Glaxo Wellcome House, Berkeley
Avenue, Greenford, Middlesex UB6 ONN

Nacionalidad o Domicilio: Británica

Lugar de Constitución: Inglaterra

Teléfono: _____

Fax: _____

E-mail: _____

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número _____

3

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: CARLOS R. OLARTE

Dirección: World Trade Center Torre A
Calle 100 No. 8A-37 Piso 10. Bogotá

Teléfono: 601-7700 Fax: 601-7799

E-mail: office@olarteraisbeck.com

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número 79.782.747 Bta
TP 74.295

4

Número de expediente:

07-137.413

5

Descripción de la corrección o modificación solicitada VER PAGINA ADJUNTA

6

Comprobante de pago No. 09-35,177

Fecha

14 de Mayo 2009

7

Anexos

☒

Comprobante de pago de la tasa y Capítulo Reivindicatorio Modificado.

☐

Poderes, si fuere el caso. Documento que soporta la cesión de Derechos.

☐

Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.

8

NOMBRE: CARLOS R. OLARTE

FIRMA: _____

C.C. 79.782.747 Bta T.P. 74.295

265
266

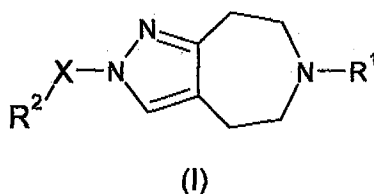
ANEXO EXPLICATIVO DE LAS MODIFICACIONES

A continuación se describen las modificaciones realizadas en el Capítulo Reivindicatorio

Reivindicación Original	Modificaciones
1	•Se ha cambiado la frase "uno ó más sustituyentes", ya que se limitó a 1, 2 ó 3 sustituyentes. •Se cambió la expresión "NR⁶CONR⁴R⁵ ó -SO₂NR⁴R⁵" por "NR⁶CONR⁴R⁵ y -SO₂NR⁴R⁵". •Se cambió la expresión "hidrógeno, alquilo de C₁₋₆" por "hidrógeno ó alquilo C₁₋₆"
3	Se cambió la expresión "heteroarilo-heterociclilo y -heterociclilo-heteroarilo por "heteroarilo-heterociclilo ó -heterociclilo-heteroarilo"
5	Se cambió la expresión "-NR ⁴ SO ₂ R ⁵ ó -SO ₂ NR ⁴ R ⁵ " por "-NR ⁴ SO ₂ R ⁵ y -SO ₂ NR ⁴ R ⁵ "
9-13	Eliminadas
—	Nueva Reivindicación 7, la cual encuentra soporte en la pagina 15, renglón 18, hasta la pagina 16, renglón 10.
—	Nuevas Reivindicaciones 8-12, las cuales encuentran soporte en la pagina 17, renglón 5, hasta la pagina 19, renglón 21.
7	Nueva Reivindicación 13: Se han colocado el nombre de todos los compuestos con formulas E1-E46, que corresponden a los ejemplos 1 a 46 del Capítulo Descriptivo.
—	Nuevas Reivindicaciones 14 y 15, las cuales encuentran soporte en la página 20, renglones 4-13.
8	Nueva Reivindicación 16
14	Nueva Reivindicación 17

CAPÍTULO REIVINDICATORIO MODIFICADO
(MODIFICACIONES VOLUNTARIAS)

1. Un compuesto de formula (I) ó una sal farmacéuticamente aceptable del mismo:



en donde:

R¹ representa -alquilo C₁₋₆, -cicloalquilo C₃₋₇ ó -CH₂-cicloalquilo C₃₋₇, en donde dichos grupos cicloalquilo pueden estar opcionalmente substituidos por alquilo C₁₋₃;

X representa un enlace ó -CH₂-;

R² representa -arilo, -arilo-arilo, -arilo-heteroarilo, -arilo-heterociclilo, -heteroarilo, -heteroarilo-arilo, -heteroarilo-heteroarilo, -heteroarilo-heterociclilo, -heterociclilo, -heterociclilo-arilo, -heterociclilo-heteroarilo ó -heterociclilo-heterociclilo;

en donde dichos grupos arilo, heteroarilo y heterociclilo de R² pueden estar opcionalmente substituidos por 1, 2 ó 3 sustituyentes los cuales pueden ser el mismo ó diferente, y los cuales se seleccionan del grupo compuesto por halógeno, hidroxí, ciano, nitro, =O, alquilo C₁₋₆, halo alquilo C₁₋₆, -O-halo alquilo C₁₋₆, -O- alquilo C₁₋₆, -alquilo C₁₋₆ -O-alquilo C₁₋₆, -CO₂R⁴, -COR⁴, -alquilo C₁₋₆ -COR⁴, -SR⁴, -SO₂R⁴, -SOR⁴, -OSO₂R⁴, -alquilo C₁₋₆ -SO₂R⁴, - alquilo C₁₋₆ -NR⁴SO₂R⁵, - alquilo C₁₋₆ -SO₂NR⁴R⁵, -NR⁴R⁵, - alquilo C₁₋₆ -NR⁴R⁵, - cicloalquilo C₃₋₈ -NR⁴R⁵, - CONR⁴R⁵, -NR⁴COR⁵, - alquilo C₁₋₆ -NR⁴COR⁵, - alquilo C₁₋₆ -CONR⁴R⁵, -NR⁴SO₂R⁵, - OCONR⁴R⁵, -NR⁴CO₂R⁵, -NR⁶CONR⁴R⁵ y -SO₂NR⁴R⁵ (en donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan independientemente hidrógeno ó alquilo C₁₋₆, ó en donde -NR⁴R⁵ puede representar un nitrógeno contenido en el grupo heterociclilo); y

en donde R⁴, R⁵ and R⁶ pueden estar opcionalmente substituidos por 1, 2 ó 3 sustituyentes los cuales pueden ser el mismo ó diferente, y los cuales se seleccionan del grupo compuesto por halógeno, hidroxí, ciano, amino, nitro y =O; ó solvatos del mismo.

2. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde X representa un enlace.
3. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1 ó 2, en donde R² representa -arilo, -arilo-heterociclilo, -arilo-heteroarilo, -heteroarilo-heterociclilo ó -heterociclilo-heteroarilo.
4. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 3, en donde R² representa -arilo-heterociclilo ó -heteroarilo-heterociclilo.
5. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones precedentes, en donde los sustituyentes en los grupos arilo, heteroarilo ó heterociclilo de R² se seleccionan de

halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, =O, -alquilo C₁₋₆, halo alquilo C₁₋₆, -O-halo alquilo C₁₋₆, -O- alquilo C₁₋₆, -SO₂R⁴, -CONR⁴R⁵, -NR⁴COR⁵, -NR⁴SO₂R⁵ y -SO₂NR⁴R⁵.

6. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones precedentes, en donde R⁴, R⁵ y R⁶ se seleccionan independientemente de hidrógeno y alquilo C₁₋₃.

7. Un compuesto de formula (I) ó una sal ó solvato farmacéuticamente aceptable del mismo como se reivindicó en cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 6, en donde:

R¹ representa - alquilo C₁₋₆, - cicloalquilo C₃₋₇ or -CH₂- cicloalquilo C₃₋₇;

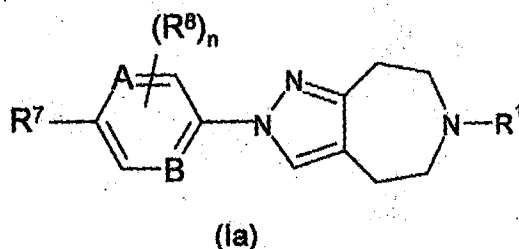
X representa un enlace;

R² representa -arilo, -arilo-heterociclilo, -arilo-heteroarilo, -heteroarilo-heterociclilo ó -heterociclilo-heteroarilo;

en donde dichos grupos arilo, heteroarilo y heterociclilo de R² pueden estar opcionalmente substituidos por 1, 2 ó 3 substituyentes los cuales pueden ser el mismo ó diferente, y los cuales se seleccionan del grupo compuesto por halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, =O, alquilo C₁₋₆, halo alquilo C₁₋₆, -O-halo alquilo C₁₋₆, -O- alquilo C₁₋₆, -SO₂R⁴, -CONR⁴R⁵, -NR⁴COR⁵, -NR⁴SO₂R⁵ y -SO₂NR⁴R⁵; y

en donde R⁴ y R⁵ se seleccionan independientemente de hidrógeno y alquilo C₁₋₆.

8. Un compuesto ó sal como se reivindicó en la Reivindicación 1, el cual es un compuesto de formula (Ia) ó una sal ó solvato farmacéuticamente aceptable del mismo:



en donde:

R¹ representa - alquilo C₁₋₆, - cicloalquilo C₃₋₇ ó -CH₂-cicloalquilo C₃₋₇;

A y B representan independientemente CH ó N;

R⁷ representa hidrógeno, hidroxilo, halógeno, ciano, nitro, -alquilo C₁₋₆, halo alquilo C₁₋₆, -O-halo alquilo C₁₋₆, -O- alquilo C₁₋₆, -NR^{4a}R^{5a}, -CONR^{4a}R^{5a}, -NR^{4a}COR^{5a}, -SO₂R^{4a}, -NR^{4a}SO₂R^{5a} ó -SO₂NR^{4a}R^{5a},

en donde R^{4a} y R^{5a} representan independientemente hidrógeno ó alquilo C₁₋₆, ó en donde NR^{4a}R^{5a} puede representar un nitrógeno contenido en un grupo heterociclilo el cual puede estar opcionalmente substituido por 1, 2 ó 3 substituyentes seleccionados independientemente de =O y alquilo C₁₋₃;

R⁸ representa hidroxilo, halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁₋₆, halo alquilo C₁₋₆, -O-halo alquilo C₁₋₆, ó -O- alquilo C₁₋₆; y

n representa 0 ó 1.

9. Un compuesto ó sal como se reivindicó en la Reivindicación 8, en donde A y B ambos representan CH.

10. Un compuesto ó sal como se reivindicó en la Reivindicación 8 ó 9, en donde R⁷ representa -NR^{4a}R^{5a} ó -CONR^{4a}R^{5a}, en donde R^{4a} y R^{5a} representan independientemente hidrógeno ó alquilo C₁₋₆, ó en donde NR^{4a}R^{5a} representa un nitrógeno contenido en un grupo heterocíclico el cual puede estar opcionalmente sustituido por 1, 2 ó 3 sustituyentes seleccionados independientemente de =O y alquilo C₁₋₃.

11. Un compuesto ó sal como se reivindicó en la Reivindicación 8, 9 ó 10, en donde R^{4a} y R^{5a} representan independientemente hidrógeno ó alquilo C₁₋₃.

12. Un compuesto ó sal como se reivindicó en la Reivindicación 8, 9, 10 ó 11, en donde n es 0.

13. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, el cual es:

N,N-dimetil-4-[6-(2-metilpropil)-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il]benzamida,
N,N-dimetil-4-[6-(1-metiletil)-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il]benzamida,
4-(6-ciclobutil-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il)-N,N-dimetilbenzamida,
4-(6-ciclopentil-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il)-N,N-dimetilbenzamida,
N-metil-4-[6-(2-metilpropil)-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il]benzamida,
N-metil-4-[6-(1-metiletil)-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il]benzamida,
4-(6-ciclobutil-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il)-N-metilbenzamida,
4-(6-ciclopentil-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il)-N-metilbenzamida,
3-{4-[6-(1-metiletil)-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il]fenil}-1,3-oxazolidin-2-ona,
1-metil-3-{4-[6-(1-metiletil)-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il]fenil}-2-imidazolidinona,
1-metil-3-{4-[6-(2-metilpropil)-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il]fenil}-2-imidazolidinona,
1-[5-(6-ciclobutil-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il)-2-piridinil]-2-pirrolidona,
1-[4-(6-ciclobutil-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il]fenil]-2-pirrolidona,
1-[4-[6-(1-metiletil)-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il]fenil]-2-pirrolidona,
6-(1-metiletil)-2-[4-(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)fenil]-2,4,5,6,7,8-hexahidropirazolo[3,4-d]azepina,
4-[6-(2-metilpropil)-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il]benzamida,
4-[6-(1-metiletil)-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il]benzamida,
1-[4-(6-etil-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il]fenil]-2-pirrolidona,
1-[4-[6-(ciclopropilmetil)-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il]fenil]-2-pirrolidona,
1-[4-[6-(2-metilpropil)-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il]fenil]-2-pirrolidona,
2-[4-(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)fenil]-6-(2-metilpropil)-2,4,5,6,7,8-hexahidropirazolo[3,4-d]azepina,
1-[4-(6-ciclohexil-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il]fenil]-2-pirrolidona,

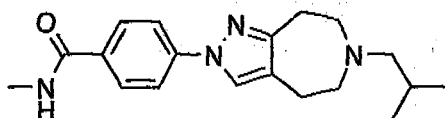
271

4-(6-ciclopentil-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il)benzamida,
1-[4-(6-ciclopentil-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il)fenil]-2-pirrolidona,
6-ciclobutil-2-[4-(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)fenil]-2,4,5,6,7,8-hexahidropirazolo[3,4-d]azepina,
4-(6-ciclobutil-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il)benzamida,
6-ciclopentil-2-[4-(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)fenil]-2,4,5,6,7,8-hexahidropirazolo[3,4-d]azepina,
6-ciclobutil-2-[4-(metilsulfonil)fenil]-2,4,5,6,7,8-hexahidropirazolo[3,4-d]azepina,
N-[4-(6-ciclobutil-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il)fenil]metanosulfonamida,
3-[4-(6-ciclopentil-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il)fenil]-1,3-oxazolidin-2-ona,
1-[4-(6-ciclopentil-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il)fenil]-3-metil-2-imidazolidinona,
4-(6-ciclobutil-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il)benzonitrilo,
4-[6-(2-metilpropil)-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il]benzonitrilo,
4-[6-(1-metiletil)-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il]benzonitrilo,
2-(4-bromofenil)-6-ciclobutil-2,4,5,6,7,8-hexahidropirazolo[3,4-d]azepina,
1-[4-(6-ciclobutil-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il)fenil]-3-metil-2-imidazolidinona,
3-[4-(6-ciclobutil-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il)fenil]-1,3-oxazolidin-2-ona,
3-[4-(6-ciclobutil-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il)fenil]-1-metil-2,4-imidazolidindiona,
6-ciclobutil-2-[4-(4-morfolinil)fenil]-2,4,5,6,7,8-hexahidropirazolo[3,4-d]azepina,
6-ciclobutil-2-[4-(1-piperidinil)fenil]-2,4,5,6,7,8-hexahidropirazolo[3,4-d]azepina,
6-ciclobutil-2-[4-(1-pirrolidinil)fenil]-2,4,5,6,7,8-hexahidropirazolo[3,4-d]azepina,
3-[4-[6-(2-metilpropil)-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il]fenil]-1,3-oxazolidin-2-ona,
1-[5-[6-(1-metiletil)-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il]-2-piridinil]-2-pirrolidona,
6-ciclobutil-2-[1-(6-metil-3-piridinil)-4-piperidinil]-2,4,5,6,7,8-hexahidropirazolo[3,4-d]azepina,
6-ciclobutil-2-fenil-2,4,5,6,7,8-hexahidropirazolo[3,4-d]azepina, ó
4-[6-(6-ciclobutil-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il)metil]benzonitrilo;

ó una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

14. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, el cual es:

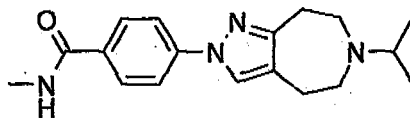
N-metil-4-[6-(2-metilpropil)-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il]benzamida



ó una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

15. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, el cual es:

N-metil-4-[6-(1-metiletil)-5,6,7,8-tetrahidropirazolo[3,4-d]azepin-2(4H)-il]benzamida



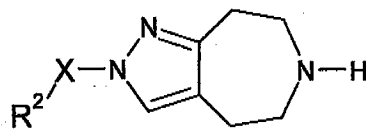
ó una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

272
7/272

16. Una composición farmacéutica la cual comprende el compuesto de formula (I) como se define en cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 15 ó una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, y un vehículo ó excipiente farmacéuticamente aceptable.

17. Un proceso para la preparación de un compuesto de formula (I) como se define en la Reivindicación 1 ó una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, el cual comprende:

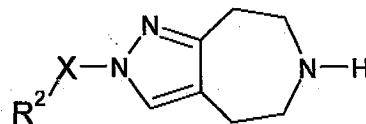
(a) hacer reaccionar un compuesto de formula (II)



(II)

en donde X y R² son como se definen en la Reivindicación 1, con un compuesto de formula R¹'=O, en donde R¹' es alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₇ ó CH- cicloalquilo C₃₋₇, en donde los grupos cicloalquilo pueden estar opcionalmente substituidos por alquilo C₁₋₃; ó

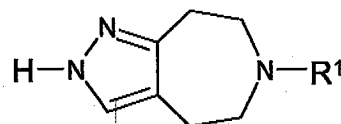
(b) hacer reaccionar un compuesto de formula (II)



(II)

en donde X y R² son como se definen en la Reivindicación 1, con un compuesto de formula R¹-L², en donde R¹ es como se define en la Reivindicación 1 y en donde L² es un grupo saliente adecuado tal como un halógeno; ó

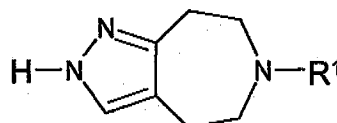
(c) hacer reaccionar un compuesto de formula (VI)



(VI)

en donde R¹ es como se define en la Reivindicación 1, con un compuesto de formula R²-X-B(OH)₂ en donde R² es arilo, arilo-arilo, arilo-heteroarilo, arilo-heterociclilo, heteroarilo, heteroarilo-arilo, heteroarilo-heteroarilo ó heteroarilo-heterociclilo y X es un enlace; ó

(d) hacer reaccionar un compuesto de formula (VI)

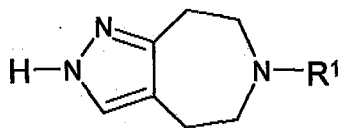


273
8273

(VI)

en donde R^1 es como se define en la Reivindicación 1, con un compuesto de formula R^2-X-L^1 en donde R^2 es como se define en la Reivindicación 1, en donde X es un enlace, y en donde L^1 es un grupo saliente adecuado tal como un halógeno; ó

- (e) hacer reaccionar un compuesto de formula (VI)



(VI)

en donde R^1 es como se define en la Reivindicación 1, con un compuesto de formula R^2-X-L^1 en donde R^2 es como se define en la Reivindicación 1, en donde X es $-CH_2-$, y en donde L^1 es un grupo saliente adecuado tal como un halógeno; ó

- (f) la desprotección un compuesto de formula (I) el cual está protegido; ó
- (g) la interconversión de un compuesto de formula (I) por otro.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 000136009

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 07-137413-00003-0000

Fecha: 2009-05-15 18:12:13 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 9

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 35,777
FECHA : MAYO 14 DE 2009

CONSIGNACION

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PAGO	VAL. PAGO
OLARTE RAISBEK	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	105000321	14/05/2009	5,238,000.00

CONCEPTO

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
12		MARCAS Y LEAS COMERCIALES	111,000.00
TOTAL :			111,000.00

SON: CIENTO ONCE MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.