



No. 08-075686- -00001-0000

Fecha: 2008-09-03 16:36:57 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 8

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

P2008/000121

SOLICITUD DE:

1

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Solicitud.

2

SOLICITANTE
(71)

Nombre: ELI LILLY AND COMPANY

Dirección: Lilly Corporate Center,
Indianapolis, Indiana 46285 E.U.A.

Nacionalidad o Domicilio: Estadounidense

Lugar de Constitución: Estados Unidos

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Teléfono: _____ **Fax:** _____
E-mail: _____

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:
08-075.686

5

Descripción de la corrección o modificación solicitada VER PAGINA ADJUNTA.

6

Comprobante de pago No. 08-70,048

Fecha Sept 3, 2008

7

Anexos

☒

Comprobante de pago de la tasa.

☐

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

267
2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 70,048
FECHA : SEPTIEMBRE 3 DE 2008

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-075686- -00001-0000

Fecha: 2008-09-03 16:36:57 Dep. 2020 NUECREACIONI
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 8

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
RAISBEK	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	81230192	03/09/2008	2,452,000.00

***** CONCEPTO *****

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

SDN: CIENTO TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

ANEXO EXPLICATIVO DEL CAPÍTULO REIVINDICATORIO MODIFICADO

**** Para la reivindicación 1:**

- Se reemplaza "indol" por "compuesto".
- Se limitó sustancialmente el alcance de los radicales de R1 hasta R13, específicamente en R1, se definieron los posibles sustituyentes heteroarilo.

**** Las reivindicaciones 2 a 4, 7, 8, y 13 a 17 fueron eliminadas.**

**** Para las reivindicaciones 5, 6 y 12 originales se limitó el alcance de los radicales.**

**** Se adiciona la reivindicación 5 que se dirige a una modalidad específica de la invención, que se encuentra dentro del alcance de la Reivindicación 1.**

**** En la reivindicación 10 original se adicionó la palabra "vehículo".**

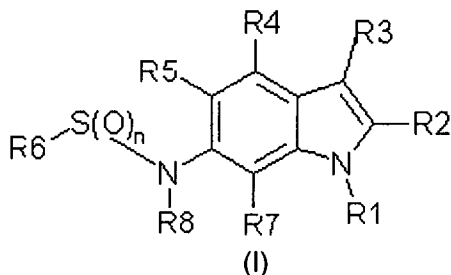
**** Las reivindicaciones 5, 6, 9, 10 a 12, y 18 a 20 son reenumeradas como nuevas reivindicaciones 2 a 11.**

OK

CAPÍTULO REIVINDICATORIO MODIFICADO

Habiéndose descrito la invención como antecede, se reclama como propiedad lo contenido en las siguientes.

1. Un compuesto de Fórmula I



En donde n es 1 o 2;

R1 se selecciona de: alquilo C₁-C₈, alquilo C₁-C₆-O-alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, alquilocicloalquilo C₁-C₆, alquilo C₀-C₃C(O)OR₁₂, alquilarilo C₁-C₆, arilo, alquilpiridinilo C₁-C₆, piridinilo, tetrahydrofuranilo, tetrahydropiranilo, -SO_nalquilo C₁-C₆, -SO_nalquilocicloalquilo C₀-C₆, y -SO_npiridinilo, en donde cada uno del arilo y piridinilo listados ya sea individualmente o en combinación con una porción alquilo, es opcionalmente sustituido con 1 a 3 grupos seleccionados individualmente de -CN, y -OCH₃, siempre que arilo no sea solamente di, o tri-sustituido con sustituyentes alcoxi;

R2 se selecciona de H, halo, y alquilo C₁-C₆;

R3 se selecciona de benzo[1,3]dioxol, benzotiofenilo, cromo-2-ilo, 2,3-dihidro-benzo[1,4]dioxinilo, 2,3-dihidro-benzofuranilo, 2,3-dihidro-1H-indolilo, 1,3-dihidro-benzimidazol-2-ilo, 1,3-dihidro-indol-2-ilo, furanilo, indan-1-ilo, indazolilo, isoxazolilo, fenilo, pirazolilo, piridinilo, 1,2,3,4-tetrahidro-quinolinilo, tiofenilo, y tiazolilo, cada uno opcionalmente sustituido con 1 a 3 grupos seleccionados individualmente de: halo, -CN, -NO₂, -NH₂, alquilo C₁-C₃, alquinilo C₂-C₃, haloalquilo C₁-C₃, hidroxialquilo C₁-C₃, alquilo -OC₁-C₃, haloalquilo -OC₁-C₃, -SCH₃, -(C(S)NH₂), -C=N-OH, -C=N- alquilo OC₁-C₆, -C(O)OCH₃, C(O)NH₂, 1-metiltetrazol-5-ilo, C(O)R₁₂, y (C(O)NHC₃cicloalquilo);

R4, R5 y R7 son H cada uno.

R6 se selecciona de: C₁-C₆ alquilo, y tiofenilo;

R8 se selecciona de: H, alquilo C₁-C₄;

R₁₂ se selecciona de: H, alquilo C₁-C₆, alquilocicloalquilo y NH₂;

ó una sal del mismo farmacéuticamente aceptable.

2. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 1, en donde R6 es CH₃.

3. Un compuesto de Fórmula I, en donde:

R1 se selecciona de alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, alquilcicloalquilo C₁-C₆, alquilo C₁-C₄-O-alquilo C₁-C₄;

R2 es H;

R3 se selecciona de: fenilo, tiofenilo, piridinilo, pirazolilo, furanilo, tiazolilo y benzotiofenilo, cada uno opcionalmente sustituido con uno a tres grupos seleccionados individualmente de: halo, -CN, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, -NO₂, -O alquilo C₁-C₃, -C(O)R12, -C=N-O alquilo C₁-C₅, y -C=N-OH;

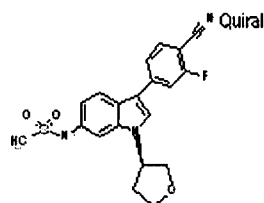
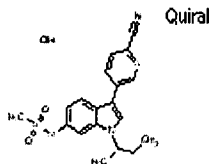
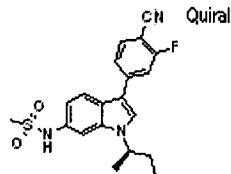
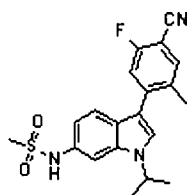
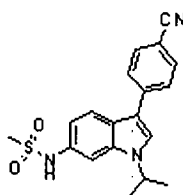
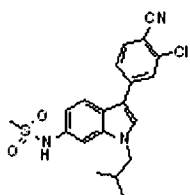
R6 es alquilo C₁-C₃;

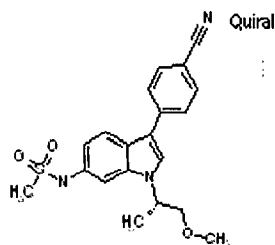
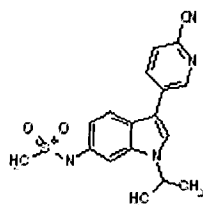
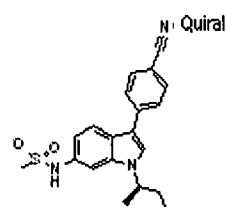
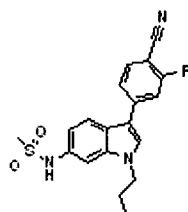
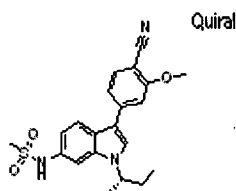
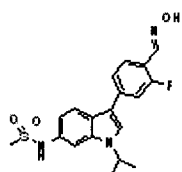
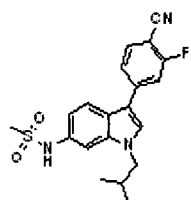
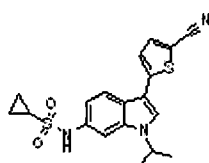
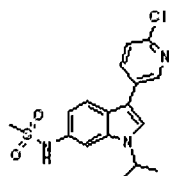
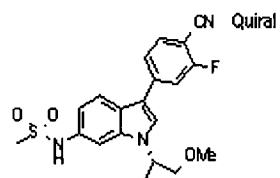
R8 es H;

R12 se selecciona de: H, alquilo C₁-C₆, y alquilcicloalquilo C₁-C₆;

ó una sal del mismo farmacéuticamente aceptable.

4. Un compuesto caracterizado porque se selecciona de lo siguiente:





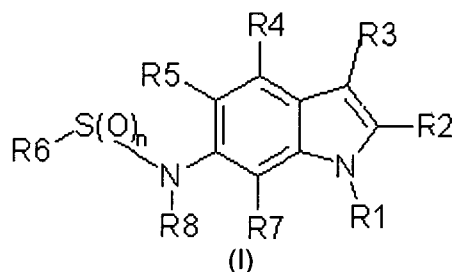
5. 2-Fluoro-4-(1-(S-3-metoxipropan-2-il)-6-metansulfonilamino-1H-indol-3-il)-benzonitrilo.

6. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-5 y al menos uno de: un vehículo, un diluyente y un excipiente.

271
J

7. Un compuesto tipo indol de Fórmula I, de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-5 para uso como un medicamento.

8. Un método para preparar un indol de fórmula I,



ó una sal del mismo farmacéuticamente aceptable del mismo,

en donde

n es 1 o 2;

R1 se selecciona de: alquilo C₁-C₈, alquilo C₁-C₆-O-alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, alquilcicloalquilo C₁-C₆, alquilo C₀-C₃C(O)OR₁₂, alquilarilo C₁-C₆, arilo, alquilpiridinilo C₁-C₆, piridinilo, tetrahydrofuranilo, tetrahydropiranilo, -SO_nalquilo C₁-C₆, -SO_nalquilcicloalquilo C₀-C₆, y -SO_npiridinilo, en donde cada uno del arilo y piridinilo listados ya sea individualmente o en combinación con una porción alquilo, es opcionalmente sustituido con 1 a 3 grupos seleccionados individualmente de -CN, y -OCH₃, siempre que arilo no sea solamente di, o tri-sustituido con sustituyentes alcoxi;

R2 se selecciona de H, halo, y alquilo C₁-C₆;

R3 se selecciona de benzo[1,3]dioxol, benzotiofenilo, cromen-2-ilo, 2,3-dihidro-benzo[1,4]dioxinilo, 2,3-dihidro-benzofuranilo, 2,3-dihidro-1H-indolilo, 1,3-dihidro-benzoimidazol-2-ilo, 1,3-dihidro-indol-2-ilo, furanilo, indan-1-ilo, indazolilo, isoxazolilo, fenilo, pirazolilo, piridinilo, 1,2,3,4-tetrahydro-quinolinilo, tiofenilo, y tiazolilo, cada uno opcionalmente sustituido con 1 a 3 grupos seleccionados individualmente de: halo, -CN, -NO₂, -NH₂, alquilo C₁-C₃, alquinilo C₂-C₃, haloalquilo C₁-C₃, hidroxialquilo C₁-C₃, alquilo -OC₁-C₃,

haloalquilo -OC₁-C₃, -SCH₃, -(C(S)NH₂), -C=N-OH, -C=N- alquilo OC₁-C₆, -C(O)OCH₃, C(O)NH₂, 1-metiltetrazol-5-ilo, C(O)R₁₂, y (C(O)NHC₃cicloalquilo);

R4, R5 y R7 son H cada uno;

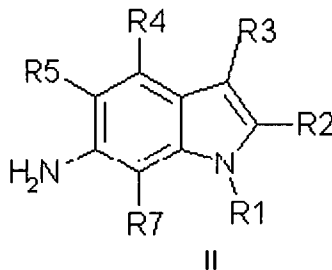
R8 se selecciona de: H, alquilo C₁-C₄;

R₁₂ se selecciona de: H, alquilo C₁-C₆, alquilcicloalquilo C₁-C₆ y NH₂;

ó una sal del mismo farmacéuticamente aceptable;

273
8

dicho método comprende combinar un compuesto de Fórmula II



con una base y R_6SO_2Cl ,
en donde R_6 se selecciona de alquilo C_1-C_6 y tiofenilo.

9. Uso de un compuesto para la manufactura de un medicamento para tratar y/o prevenir leiomiomas en un mamífero, que comprende administrar una dosis efectiva de un compuesto de Fórmula I de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-5, una sal farmacéuticamente aceptable del mismo a dicho mamífero.

10. Uso de un compuesto para la manufactura de un medicamento para tratar y/o prevenir endometriosis, que comprende administrar una cantidad efectiva de un compuesto de Fórmula I de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-5, una sal farmacéuticamente aceptable del mismo a un paciente en necesidad de lo mencionado.

11. Una composición farmacéutica, caracterizada porque comprende un compuesto de Fórmula I de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-5, para tratar leiomiomas o endometriosis.