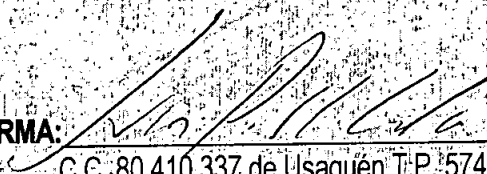




FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

1		SOLICITUD DE:	
☐ Corrección de Error Material.		☒ Modificación a una Solicitud.	
2 SOLICITANTE	Nombre: ASTRAZENECA AB		IDENTIFICACION C.C. ☐ NIT. ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Cual _____ Número _____
	Dirección: S-1-51 85 Södertälje, Suecia Nacionalidad o Domicilio: Suecia Lugar de Constitución: Suecia Teléfono: _____ Fax: _____ E-mail: _____		
3 REPRESENTANTE O APODERADO	Nombre: JUAN PABLO CADENA SARMIENTO		IDENTIFICACION C.C. ☒ NIT. ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Cual _____ Número <u>80 410.337</u> TP <u>57492</u>
	Dirección: Cra. 7 No. 71-21, Torre B, Piso 4 Teléfono: 744-2200 Fax: 742-2200 E-mail: _____		
4 Número de expediente: <u>08-119163</u>			
5 Descripción de la corrección o modificación solicitada: <u>Estamos presentando nuevo capítulo reivindicatorio, donde se han realizado algunas modificaciones, las cuales precisan el objetivo de la solicitud y no afectan en ningún sentido el alcance de la invención.</u>			
6 Comprobante de pago No. <u>08 - 62,486</u> Fecha <u>06 de noviembre de 2008</u>			
7 Anexos: ☒ Comprobante de pago de la tasa por \$103.000 ☐ Poderes, si fuere el caso. ☐ Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas. ☒ Nuevo capítulo Reivindicatorio.			
8			
NOMBRE: JUAN PABLO CADENA SARMIENTO		FIRMA:  C.C. 80.410.337 de Usaquén T.P. 57492 del C.S.J.	

Fecha: 2008-11-07 16:30:05 Dep. 2020 NUECREACIONI
Tra. 11 PATENTEIYII Eje: 378 FASENACIONALI
Act 329 CTOINFORMACION Folios: 11

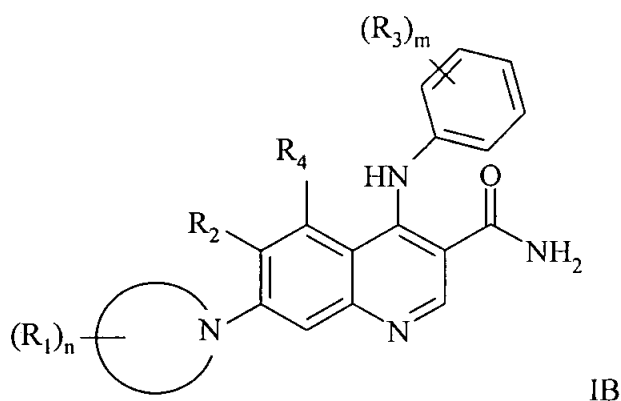
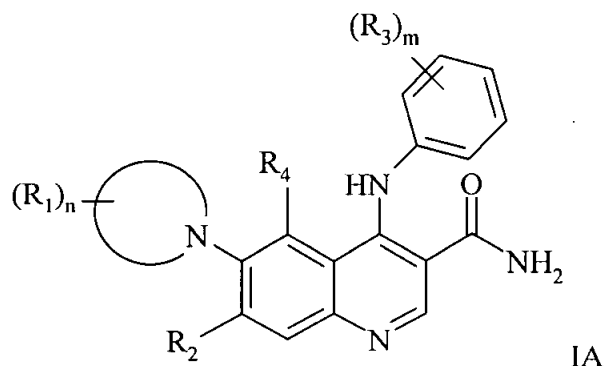
RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.

70
312

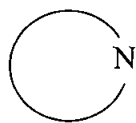
REIVINDICACIONES

Lo que se reivindica es:

1. Un compuesto de fórmula IA ó IB:



ó una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde:



es un heterociclo ó heteroaril, unido al nitrógeno, de 3–10 miembros; en donde si dicho heterociclo ó heteroaril contiene una fracción $-\text{NH}-$ ese nitrógeno puede ser opcionalmente sustituido por un grupo seleccionado de R_5 ;

R_1 en cada aparición es independientemente halo, hidroxil, nitro, formil, ciano, $-\text{CO}_2\text{H}$, $-\text{SH}$, (C_1-C_6) alquil, (C_2-C_6) alquenil, (C_2-C_6) alquinil, (C_3-C_6) cicloalquil, (C_1-C_6) alcoxi, $-\text{OC}(\text{O})-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ alquil, $-\text{C}(\text{O})-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ alquil, $-\text{CO}_2(\text{C}_1-\text{C}_6)$ alquil, $-\text{NR}'\text{R}''$, $-\text{NR}'-\text{C}(\text{O})-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ alquil, (C_1-C_6) alquil $\text{S}(\text{O})_a-$ donde a es 0 a 2, $-\text{NR}'-\text{C}(\text{O})-\text{O}(\text{C}_1-\text{C}_6)$ alquil, $-\text{NR}'-\text{SO}_2-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ alquil, $-\text{NR}'-\text{C}(\text{O})\text{NR}'\text{R}''$, $-\text{SO}_2-\text{NR}'\text{R}''$, $-\text{C}(\text{O})-\text{NR}'\text{R}''$, carbocicil, heterociclo, heteroaril u oxo;

R_2 es hidrógeno, halo, hidroxil, nitro, formil, $-\text{CO}_2\text{H}$, $-\text{SH}$, ciano, (C_1-C_6) alquil, (C_2-C_6) alquenil, (C_2-C_6) alquinil, (C_3-C_6) cicloalquil, $-\text{O}-(\text{C}_3-$

JH

C_6)cicloalquil, $-OC(O)-(C_1-C_6)$ alquil, $-C(O)-(C_1-C_6)$ alquil, $-CO_2(C_1-C_6)$ alquil, $-NR'R''$, $-NR'-C(O)-(C_1-C_6)$ alquil, (C_1-C_6) alquil $S(O)_a-$ donde a es 0 a 2, $-NR'-C(O)-O(C_1-C_6)$ alquil, $-NR'-SO_2-(C_1-C_6)$ alquil, $-NR'-C(O)NR'R''$, $-SO_2-NR'R''$, $-C(O)-NR'R''$, $-OC(O)-NR'R''$, carbociclil, heterociclo, heteroaril o (C_1-C_6) alcoxi;

R_3 en cada aparición es independientemente halo, nitro, formil, ciano, hidroxil, $-NR'R''$, $-CO_2H$, $-C(O)-(C_1-C_6)$ alquil, $-CO_2(C_1-C_6)$ alquil, $-C(O)-NR'R''$, $-NR'-C(O)-(C_1-C_6)$ alquil, $-NR'-C(O)NR'R''$, $-NR'-C(O)-O(C_1-C_6)$ alquil, $-O-C(O)-(C_1-C_6)$ alquil, $-SH$, $-SO_2-NR'R''$, (C_1-C_6) alquil, (C_2-C_6) alquenil, (C_2-C_6) alquinil, (C_1-C_6) alcoxi, (C_1-C_6) alquil $S(O)_a-$ en donde a es 0 a 2, $-NR'-SO_2-(C_1-C_6)$ alquil, carbociclil, heterociclo, o heteroaril, en donde si dicho heterociclo o heteroaril contiene una fracción $-NH-$ ese nitrógeno puede ser opcionalmente sustituido por (C_1-C_6) alquil; o

dos grupos R_3 en carbonos adyacentes pueden formar opcionalmente un anillo saturado, parcialmente insaturado, insaturado y/o aromático de 5 ó 6 miembros que contiene opcionalmente 0, 1, ó 2 heteroátomos seleccionados de S, O, ó NR_a donde R_a está ausente, H ó (C_1-C_6) alquil;

R_4 es hidrógeno o halo;

m es 0–3; en donde los valores de R_3 pueden ser los mismos ó diferentes;

n es 0–3; en donde los valores de R_1 pueden ser los mismos o diferentes;

p es independientemente 1 ó 2 en cada aparición; y

R_5 es seleccionado de (C_1-C_6) alquil, (C_3-C_6) cicloalquil, $-C(O)-(C_1-C_6)$ alquil, $-S(O)_p(C_1-C_6)$ alquil, $-CO_2(C_1-C_6)$ alquil, $-C(O)-NR'R''$, bencil, benciloxycarbonil, benzoil y fenilsulfonil;

R' y R'' independientemente en cada aparición son H, opcionalmente sustituido (C_1-C_6) alquil, u opcionalmente sustituido aril, o tomados juntos con el nitrógeno al cual están unidos forman un anillo de 3–6 miembros opcionalmente sustituido saturado o parcialmente insaturado que contiene 0 ó 1 heteroátomo adicional seleccionado de NR_a ; en donde dichos sustituyentes opcionales pueden ser seleccionados de uno o más R_6 ;

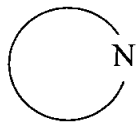
R_6 puede ser independientemente (C_1-C_6) alquil, halo (C_1-C_6) alquil, halo, nitro, ciano, hidroxil, (C_1-C_6) alcoxi, $-NR^xR^y$, $-COOR^x$ o $-CONR^xR^y$; y

R^x y R^y son independientemente uno de otro hidrógeno o (C_1-C_6) alquil; y en donde cada R_a , R_1 , R_2 , R_3 y R_5 puede ser opcionalmente sustituido en el carbono por uno ó más formil, $-SH$, azido, halo, nitro, ciano, hidroxil,

Handwritten signature and date: 3/14

trifluorometoxi, $-\text{OC}(\text{O})-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{alquil}$, $-\text{NR}'\text{R}''$, $-\text{CO}_2\text{H}$, $-\text{C}(\text{O})-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{alquil}$, $-\text{CO}_2(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{alquil}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{NR}'\text{R}''$, $-\text{S}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{alquil}$, $-\text{SO}_p-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{alquil}$, $-\text{SO}_p\text{NR}'\text{R}''$, $(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{alquil}$, $(\text{C}_3-\text{C}_6)\text{cicloalquil}$, $-\text{NR}'-\text{C}(\text{O})-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{alquil}$, $-\text{NR}'-\text{C}(\text{O})-\text{O}(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{alquil}$, $-\text{NR}'-\text{SO}_2-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{alquil}$, $-\text{NR}'-\text{C}(\text{O})\text{NR}'\text{R}''$, $(\text{C}_2-\text{C}_6)\text{alquenil}$, $(\text{C}_2-\text{C}_6)\text{alquinil}$, o $(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{alcoxi}$.

2. Un compuesto de fórmula IA como el reivindicado en la reivindicación 1 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
3. Un compuesto de fórmula IB como el reivindicado en la reivindicación 1 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
4. Un compuesto de fórmula IA o IB o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo como el reivindicado en una cualquiera de las reivindicaciones 1-3 en donde:



es un heterociclo, unido al nitrógeno, de 5-7 miembros; en donde si dicho heterociclo contiene una fracción $-\text{NH}-$ ese nitrógeno puede ser opcionalmente sustituido por un grupo seleccionado de R_5 ; en donde

R_5 es seleccionado de $(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{alquil}$, $(\text{C}_3-\text{C}_6)\text{cicloalquil}$, $-\text{C}(\text{O})-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{alquil}$ y $-\text{CO}_2(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{alquil}$; y

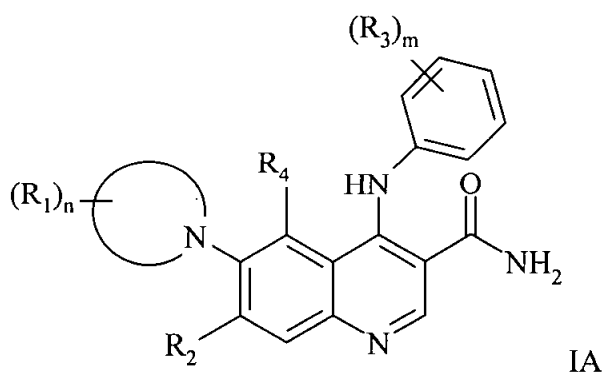
cada R_5 puede ser opcionalmente sustituido en el carbono por uno o más ciano, hidroxil, $-\text{OC}(\text{O})-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{alquil}$, $-\text{NR}'\text{R}''$, $(\text{C}_3-\text{C}_6)\text{cicloalquil}$ o $(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{alcoxi}$; en donde

R' y R'' independientemente en cada aparición son $(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{alquil}$.

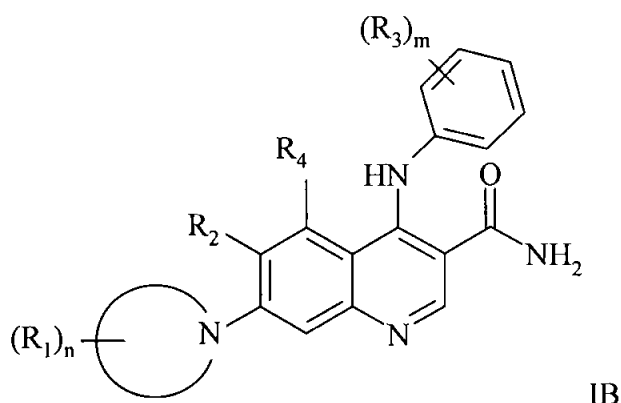
5. Un compuesto de fórmula IA ó IB ó una sal farmacéuticamente aceptable del mismo como el reivindicado en cualquiera de las reivindicaciones 1-4 en donde R_1 en cada aparición es hidroxil, $-\text{NR}'\text{R}''$ u oxo; donde R' y R'' independientemente en cada aparición son $(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{alquil}$.
6. Un compuesto de fórmula IA ó IB ó una sal farmacéuticamente aceptable del mismo como el reivindicado en cualquiera de las reivindicaciones 1-5 en donde n es 0 ó 1.

6-315

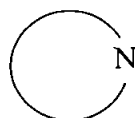
7. Un compuesto de fórmula IA ó IB ó una sal farmacéuticamente aceptable del mismo como el reivindicado en cualquiera de las reivindicaciones 1-6 en donde R_2 es hidrógeno, halo o (C_1-C_6) alcoxi; donde R_2 puede ser opcionalmente sustituido en el carbono por uno ó más (C_1-C_6) alcoxi ó hidroxilo.
8. Un compuesto de fórmula IA ó IB ó una sal farmacéuticamente aceptable del mismo como el reivindicado en cualquiera de las reivindicaciones 1-7 en donde R_3 en cada aparición es independientemente halo, (C_1-C_6) alquil ó (C_1-C_6) alcoxi; donde R_3 puede ser opcionalmente sustituido en el carbono por halo.
9. Un compuesto de fórmula IA ó IB ó una sal farmacéuticamente aceptable del mismo como el reivindicado en cualquiera de las reivindicaciones 1-8 en donde m es 1-3; donde los valores de R_3 pueden ser los mismos ó diferentes.
10. Un compuesto de fórmula IA ó IB ó una sal farmacéuticamente aceptable del mismo como el reivindicado en cualquiera de las reivindicaciones 1-9 en donde R_4 es hidrógeno ó fluoro.
11. Un compuesto de fórmula IA ó IB:



JP 2016



en donde:



es piperazin-1-il, *N*-metilpiperazin-1-il, *N*-etilpiperazin-1-il, *N*-isopropilpiperazin-1-il, *N*-acetilpiperazin-1-il, *N*-(2-hidroxiacetil)piperazin-1-il, *N*-(2-dimetilaminoetil)piperazin-1-il, *N*-(2-metoxietil)piperazin-1-il, *N*-(2-cianoetil)piperazin-1-il, *N*-(2-hidroxietil)piperazin-1-il, *N*-(ciclopropilmetil)piperazin-1-il, *N*-(ciclopropil)piperazin-1-il, *N*-((*R*)-2-hidroxiopropionil)piperazin-1-il, *N*-((*S*)-2-hidroxiopropionil)piperazin-1-il, *N*-(*t*-butoxicarbonil)piperazin-1-il, *N*-(acetoxiacetil)piperazin-1-il, piperidin-1-il, morfolino, homopiperazin-1-il, *N*-metilhomopiperazin-1-il, *N*-etilhomopiperazin-1-il, *N*-acetilhomopiperazin-1-il, *N*-isopropilhomopiperazin-1-il, *N*-ciclopropilhomopiperazin-1-il y pirrolidin-1-il;

R_1 en cada aparición es hidroxil, $-NMe_2$ u oxo;

n es 0 ó 1;

R_2 es hidrógeno, fluoro, metoxi, etoxi, 2-(metoxi)etoxi, 2-hidroxietoxi ó isopropoxi;

R_3 en cada aparición es independientemente fluoro, cloro, metil, trifluorometil, etil, metoxi ó trifluorometoxi;

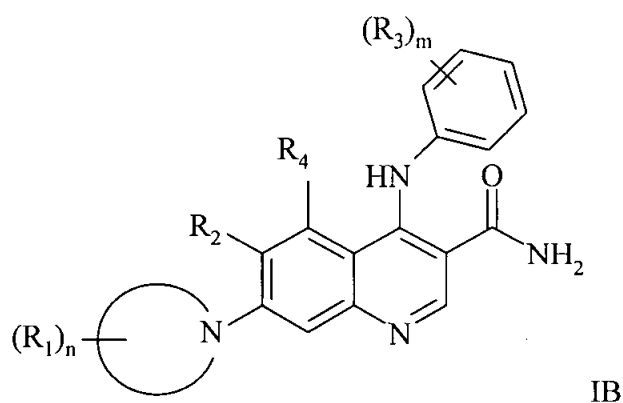
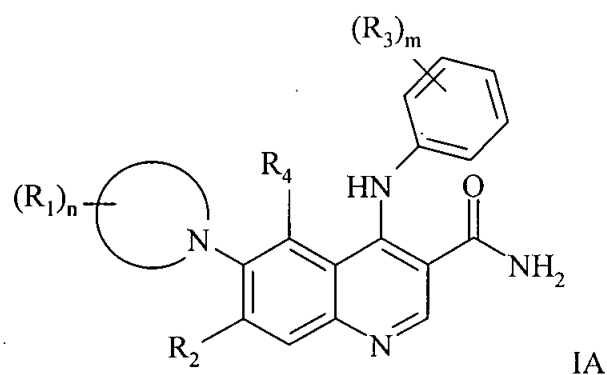
m es 1-3; donde los valores de R_3 pueden ser los mismos ó diferentes;

R_4 es hidrógeno ó fluoro;

ó una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

12. Un compuesto de fórmula IA ó IB:

318

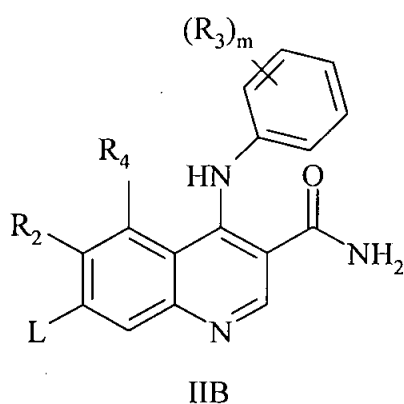
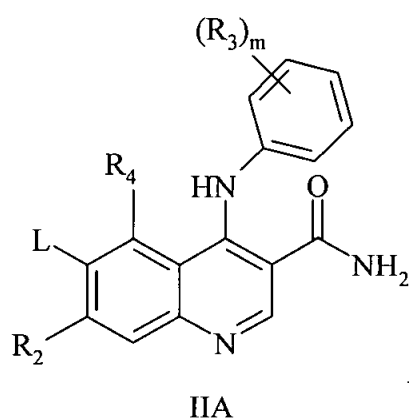


seleccionado de:

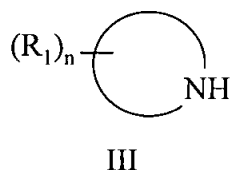
- 4-[(2,4-difluorofenil)amino]-7-etoxi-6-(4-metilpiperazin-1-il)quinolina-3-carboxamida;
- 4-[(2,3-diclorofenil)amino]-7-etoxi-6-(4-metilpiperazin-1-il)quinolina-3-carboxamida;
- 7-etoxi-4-[(2-fluoro-5-metilfenil)amino]-6-(4-isopropilpiperazin-1-il)quinolina-3-carboxamida;
- 4-[(3-cloro-2-fluorofenil)amino]-7-etoxi-6-(4-metilpiperazin-1-il)quinolina-3-carboxamida;
- 7-etoxi-4-[(2-fluoro-5-metilfenil)amino]-6-(4-metilpiperazin-1-il)quinolina-3-carboxamida;
- 7-etoxi-4-[(2-fluoro-4-metilfenil)amino]-6-(4-metilpiperazin-1-il)quinolina-3-carboxamida;
- 4-[(2,4-difluorofenil)amino]-7-(2-metoxietoxi)-6-(4-metilpiperazin-1-il)quinolina-3-carboxamida;
- 4-[(2-fluoro-4-metilfenil)amino]-7-(2-metoxietoxi)-6-(4-metilpiperazin-1-il)quinolina-3-carboxamida;
- 4-[(2-fluoro-5-metilfenil)amino]-7-(2-metoxietoxi)-6-(4-metilpiperazin-1-il)quinolina-3-carboxamida; y
- 4-[(2-fluoro-4-metilfenil)amino]-6-(4-isopropilpiperazin-1-il)-7-(2-metoxietoxi)quinolina-3-carboxamida.

13. Un proceso para preparar un compuesto de fórmula IA ó IB ó una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, como el reivindicado en la reivindicación 1, cuyo proceso, en donde los grupos variables son, a menos que se especifique lo contrario, como los definidos en la reivindicación 1, está compuesto de:

Proceso a) reaccionar un compuesto de fórmula IIA ó IIB:

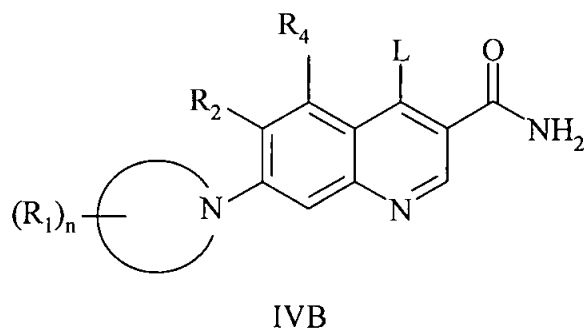
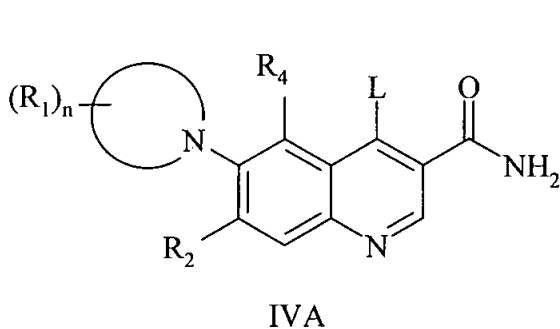


donde L es un grupo ó átomo desplazable; con un compuesto de fórmula III:

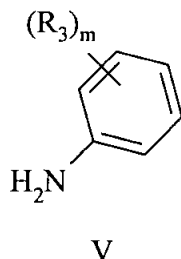


ó

Proceso b) reaccionar un compuesto de fórmula IVA o IVB:



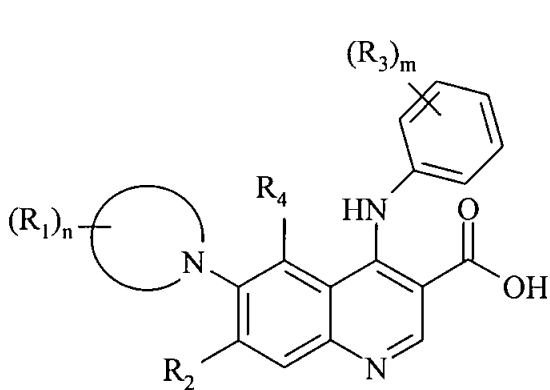
donde L es un grupo o átomo desplazable; con un compuesto de fórmula V:



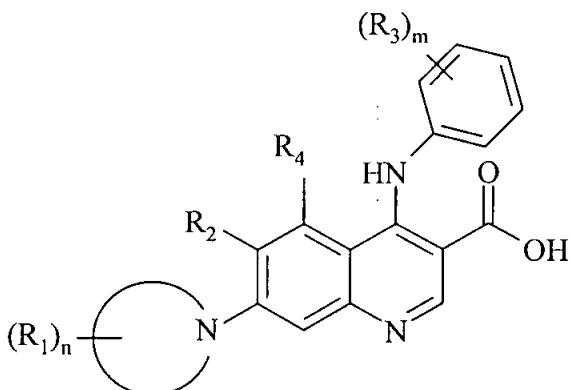
10/3/94

ó

Proceso c) reaccionar un compuesto de fórmula VIA ó VIB:



VIA

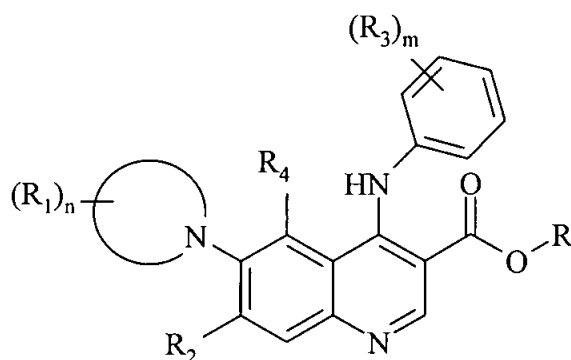


VIB

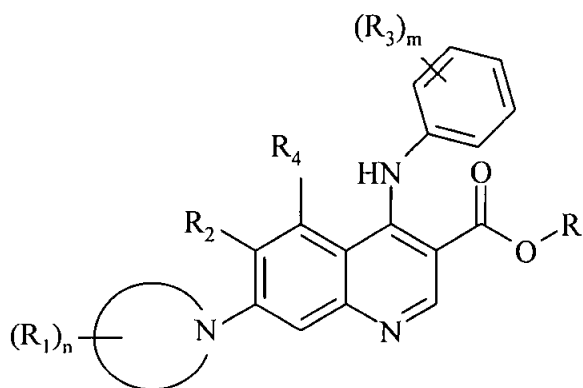
ó un derivado activado del mismo; con amoníaco;

ó

Proceso d) reaccionar un compuesto de fórmula VIIA ó VIIB:



VIIA



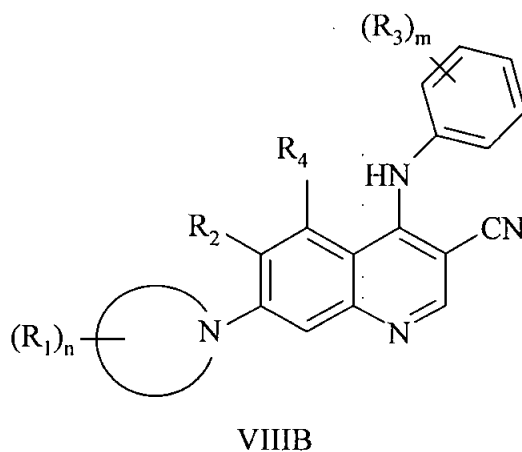
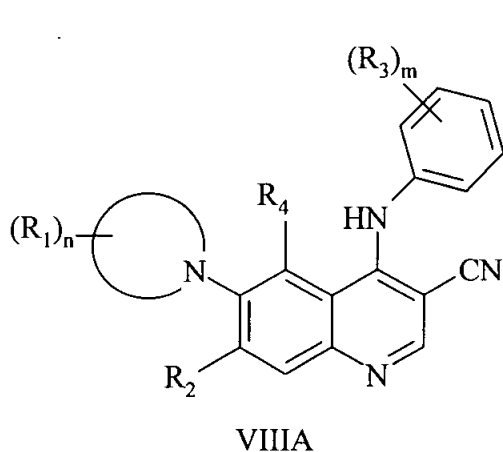
VIIB

en donde R es (C₁-C₆)alquil, en particular metil y etil; con formamida y una base;

ó

Proceso e) hidrólisis de un compuesto de fórmula VIIIA ó VIIB:

Handwritten signature/initials.



y a continuación si fuera necesario:

- i) convertir un compuesto de la fórmula IA ó IB en otro compuesto de la fórmula IA ó IB;
- ii) eliminar cualquier grupo de protección;
- iii) formar una sal farmacéuticamente aceptable.

14. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de fórmula IA ó IB, ó una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, como el reivindicado en cualquiera de las reivindicaciones 1–12, en asociación con un portador ó diluyente farmacéuticamente aceptable.
15. Un compuesto de la fórmula IA ó IB, ó una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, como el reivindicado en una cualquiera de las reivindicaciones 1–12, para su uso como un medicamento.

321

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Bogotá,
2020

Doctor(a)
CADENA SARMIENTO JUAN PABLO
Apoderado(a) y/o Representante de
ASTRAZENECA AB

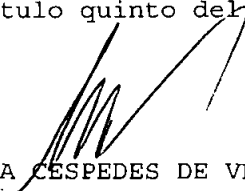
REFERENCIA	Radicación No.	8 119163
	Solicitud internacional	PCT/GB2007/001338
	Fecha inicio fase nacional	14/11/2008
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	014879

Como resultado del examen de forma, realizado con fundamento en el artículo 38 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, artículo 27 del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), regla 51 bis del Reglamento y Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se le comunica que:

1. La solicitud no contiene la copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente del inventor al solicitante o a su causante, conforme a lo establecido por el artículo 26 literal k) de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina. Cuando se trate de documentos otorgados en el extranjero, estos deberán legalizarse de conformidad con lo dispuesto por los artículos 259 y 260 del Código de Procedimiento Civil. Cuando se trate de las declaraciones a que hace referencia la Regla 4.17 ii) del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes PCT., el alcance de las tales declaraciones se determinará según indiquen claramente una cesión de derechos del inventor al solicitante o su causante, de conformidad con lo dispuesto en el numeral 5.2.15 del Capítulo Quinto, Título X de la Circular Única de Superintendencia de Industria y Comercio.

En cumplimiento de lo dispuesto por el artículo 39 de la Decisión 486, se le requiere para que dentro del término de dos meses siguientes a la fecha de notificación del presente oficio, complete los requisitos anteriormente enunciados. En caso de no dar cumplimiento al presente requerimiento, la solicitud se considerará abandonada y perderá su prelación.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única No.10 de 2001.


ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha 21 NOV. 2008
adpall