



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

FORMULARIO UNICO DE CORRECCION

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-019203-00002-0000

Es

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-019203-00002-0000

Fecha: 2009-03-26 16:59:24 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYI Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 10

1

SOLICITUD DE

☐ Corrección de Error Material

☒ X

Modificación de una solicitud

2

SOLICITANTE

Nombre: Bristol-Myers Squibb Company

Dirección: P.O. Box 4000, Route 206, and Province
Line Road, PRINCENTON, New Jersey 08543-4000
Estados Unidos de América

Nacionalidad o Domicilio: Estados Unidos de América

Lugar de Constitución: Estados Unidos de América

Teléfono:

Fax:

E-Mail

IDENTIFICACION

C.C.

NIT

C.E.

Otro

Cual

Número

3

REPRESENTANTE O APODERADO

Nombre: ALVARO CORREA ORDÓÑEZ

Dirección: Avenida 82 No.10-62 Piso 6o.

Teléfono: 634 1500

Fax: 376 2211

E-Mail: patents.bogota@bakernet.com

IDENTIFICACION

C.C.

NIT

C.E.

Otro

Cual

Número 79.143.366

TP 20.281

4

Numero de expediente

09.019.203

5

Descripción de la corrección o modificación solicitada

Presento a su despacho nuevo capítulo reivin-
dicatorio compuesto por 15 reivindicaciones. Dicho capítulo reivindicatorio
no amplía la invención originalmente presentada.

6

Comprobante de Pago No.

09-5,807

Fecha

ENE-26-2009

7

Anexos

☒ X

Comprobante de pago de la tasa.

☐

Poderes, si fuere el caso.

☐

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

8

NOMBRE ALVARO CORREA ORDÓÑEZ

FIRMA

C.C. 79.143.366

T.P. 20.281

Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página.

2000-F03

2

REIVINDICACIONES ENMENDADAS

1. Compuesto, caracterizado porque es N-((1R,2S,5R)-5-(tert-butilamino)-2-((S)-2-oxo-3-(6-(trifluorometil)quinazolin-4-ilamino)pirrolidin-1-il)ciclohexil)acetamida, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

2. Compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque es una forma cristalina de N-((1R,2S,5R)-5-(tert-butilamino)-2-((S)-2-oxo-3-(6-(trifluorometil)quinazolin-4-ilamino)pirrolidin-1-il)ciclohexil)acetamida, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

3. Forma cristalina de conformidad con las reivindicaciones 1-2, caracterizada porque comprende la forma N-2.

4. Forma cristalina de conformidad con las reivindicaciones 1-3, caracterizada por los parámetros de celdas unitarios substancialmente iguales a los siguientes:

dimensiones celulares:

20 a = 18.7240(3)

b = 8.01701(2)

c = 19.6568(5)

α = 90

β = 114.935(2))

25 γ = 90

$$V(\text{\AA}^3) = 2675.7 \text{ (1)}$$

Grupo de espacio $P2_12_12_1$

Moléculas/célula unitaria 2

en donde el cristal está a una temperatura de alrededor
5 de +22°C (T.A.).

5. Forma cristalina de conformidad con las
reivindicaciones 1-4, caracterizada porque el patrón de
difracción de rayos X en polvo comprende tres o más de los
valores 2θ ($\text{CuK}\alpha$ $\lambda=1.5418\text{\AA}$) seleccionados de 5.5, 9.1, 12.1,
10 14.0 y 19.2 a una temperatura de alrededor de 22°C.

6. Forma cristalina de conformidad con las
reivindicaciones 1-5, caracterizada además porque el patrón
de difracción de rayos X en polvo comprende cuatro o más de
los valores 2θ ($\text{CuK}\alpha$ $\lambda=1.5418\text{\AA}$) seleccionados del grupo que
15 consiste de 5.5, 9.1, 12.1, 14.0 y 19.2, a una temperatura de
alrededor de 22°C.

7. Forma cristalina de conformidad con las
reivindicaciones 1-6, caracterizada porque las coordenadas
atómicas fraccionales son substancialmente como se enlistan
20 en la Tabla 3.

8. Forma cristalina de conformidad con las
reivindicaciones 1-7, caracterizada porque tiene un patrón de
difracción de rayos X en polvo substancialmente de
conformidad con la Figura 2.

25 9. Composición farmacéutica, caracterizada porque

comprende el compuesto de conformidad con las reivindicaciones 1-8, y un portador o diluyente farmacéuticamente aceptable.

10. Método para tratar una enfermedad en un mamífero, 5
caracterizado porque comprende administrar al mamífero una cantidad terapéuticamente efectiva del compuesto de conformidad con la reivindicaciones 1-9 en donde la enfermedad se selecciona de diabetes, obesidad, síndrome metabólico, apoplejía, dolor neuropático, cardiomiopatía 10
isquémica, psoriasis, hipertensión, escleroderma, osteoartritis, aneurisma, fiebre, enfermedad cardiovascular, enfermedad de Crohn, insuficiencia cardíaca congestiva, enfermedades autoinmunes, infección por VIH, demencia asociada con VIH, psoriasis, fibrosis pulmonar idiopática, 15
arterioesclerosis por transplante, trauma cerebral físicamente o químicamente inducido, enfermedad inflamatoria del intestino, alveolitis, colitis, lupus eritematoso sistémico, nefritis de suero nefrotóxico, nefritis glomerular, asma, esclerosis múltiple, arterioesclerosis, vasculitis, placas vulnerables, artritis reumatoide, 20
restenosis, hiperplasia neoíntima venosa, hiperplasia neoíntima de injerto de diálisis, hiperplasia íntima de derivación arteriovenosa, transplante de órganos, nefropatía de aloinjerto crónico y cáncer.

11. Método de conformidad con la reivindicación 10, caracterizado porque la enfermedad se selecciona de diabetes, 25
obesidad, enfermedad de Crohn, lupus eritematoso sistémico,

glomerulonefritis, esclerosis múltiple, ateroesclerosis, restenosis, y transplante de órganos.

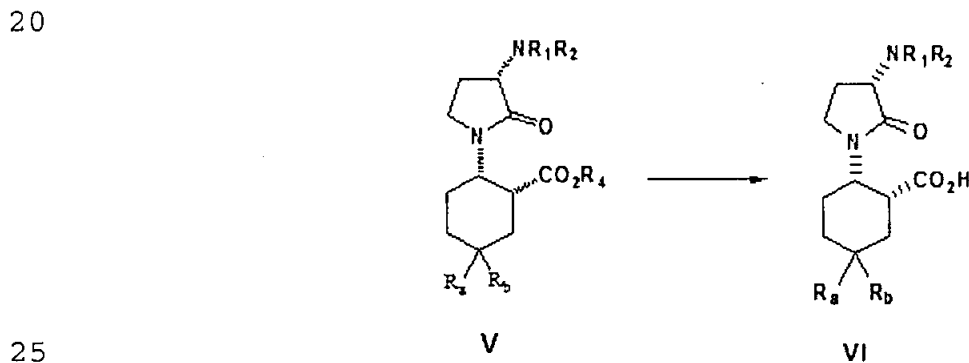
12. Método de conformidad con las reivindicaciones 10-11, caracterizado porque la enfermedad se selecciona de esclerosis múltiple, ateroesclerosis, enfermedad de Crohn, y diabetes.

13. Proceso para la preparación de un compuesto teniendo la fórmula (X)



15 caracterizado porque comprende los pasos de:

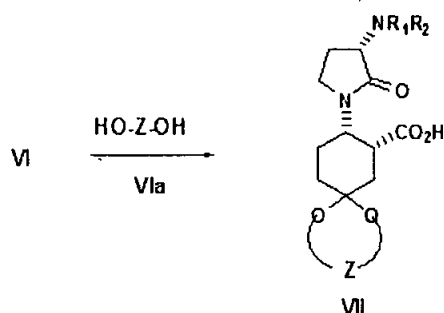
hidrolizar la porción éster del compuesto de la fórmula V con un agente de hidrolización para formar el ácido del compuesto VI a temperaturas desde alrededor de -5 hasta alrededor de 5°C.



25

reaccionando un compuesto de la fórmula VIa, HO-Z-OH, con un compuesto de la fórmula IV (opcionalmente in situ) en la presencia de un catalizador ácido para dar un compuesto de la fórmula VII

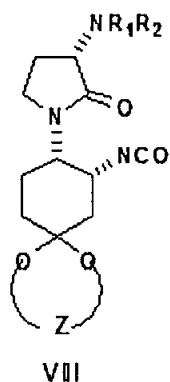
5



10

transformando la porción del ácido carboxílico de el cetal de la fórmula VII a un isocianato intermediario de la fórmula VIII

15

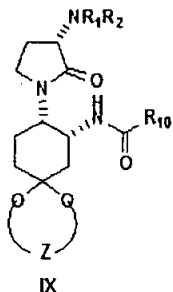


20

contactando el isocianato de la fórmula VIII con un compuesto de la fórmula $R_{10}COW$ (por ejemplo, ácido acético) en la presencia de un anhídrido ácido correspondiente, $(R_{10}CO)_2O$ para formar la amida de la fórmula IX teniendo una porción cetal:

25

7



: y

5

Hidrolizar la porción cetal de la amida de la formula IX para formar el compuesto de la formula X caracterizado porque R_1 , y R_2 son independientemente hidrógeno o un grupo protector amina;

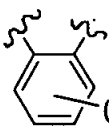
10

R_4 y R_{10} son independientemente alquilo C_{1-6} o bencilo substituido opcionalmente;

R_8 y R_9 son independientemente hidrógeno, alquilo C_{1-6} ,

W es OH o Oalquilo C_{1-6} .

15

Z es $-(CT_1T_2)_2-$, $-(CT_1T_2)_3-$, o  $(T_3)_{0-4}$ y

T_1 , T_2 y T_3 cada que se presentan se seleccionan independientemente de hidrógeno, alquilo C_{1-4} , alquenilo C_{2-4} , halógeno, hidroxí, ciano, nitro, CF_3 , Oalquilo C_{1-4} , OCF_3 , y

20

$C(=O)$ alquilo C_{1-4}

14. Proceso de conformidad con la reivindicación 13, caracterizado porque aminor reductivamente comprende las etapas de:

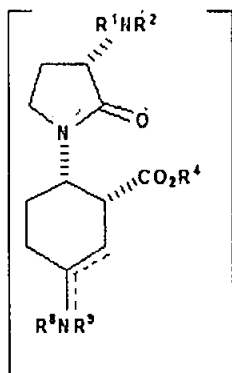
a) agregar un ácido Lewis a una solución del compuesto

25

X y la amina que tiene la fórmula HNR_8R_9 en un solvente

aprótico para formar una imina-enamina de la fórmula Xa:

5



Xa

; y

b) tratar la imina-enamina de la fórmula Xa con un agente reductor para proporcionar el compuesto de la fórmula X que tiene una porción pirolindonil amina.

15. Compuesto seleccionado de

Ácido (7R,8S)-8-((3S)-3-(((benciloxi)carbonil)amino)-2-oxo-1-pirrolidinil)-1,4-dioxaspiro[4.5]decano-7-carboxílico, o una sal del mismo;

((3S)-1-((7R,8S)-7-(azidocarbonil)-1,4-dioxaspiro[4.5]dec-8-il)-2-oxo-3-pirrolidinil)carbamato de bencilo, o una sal del mismo;

((3S)-1-((7R,8S)-7-isocianato-1,4-dioxaspiro[4.5]dec-8-il)-2-oxo-3-pirrolidinil)carbamato de bencilo, o una sal del mismo;

((3S)-1-((7R,8S)-7-acetamido-1,4-dioxaspiro[4.5]dec-8-il)-2-oxo-3-pirrolidinil)carbamato de bencilo, o una sal del mismo;

((3S)-1-((1S,2R)-2-acetamido-4-oxociclohexil)-2-oxo-3-

2009/002

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 5,807
FECHA : ENERO 26 DE 2009

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 09-019203- -00002-0000

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 09-019203- -00002-0000

Fecha: 2009-03-26 16:59:24 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 10

***** CONSIGNACION *****

POSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
BAKER & MCKENZIE	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	21549006	23/01/2009	54,828,500.00

***** CONCEPTO *****

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

SUN: CIENTO ONCE MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____