

LLORED A & CIA. S. A.

A B O G A D O S.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-053154- -00001-0000

Fecha: 2009-06-08 16:08:17 Dep. 2020 NUECREACION
 Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
 Act. 329 CTOINFORMACION Folios. 11

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

BOGOTA - COLOMBIA
 OFICINA FUNDADA EN 1941
 APARTADO AEREO 12304
 TEL: 57-1-3264270 57-1-6069700
 FAX: 57-1-3264271 57-1-6069701
 CABLES: LLORED A
 CALLE 72 No. 5-83 5º. PISO
 www.lloredacamacho.com
 jlcco@lloredacamacho.com

Re: P1.-F. HOFFMANN-LA ROCHE AG.-Solicitud de Patente de Invención
en Fase Nacional PCT para "DERIVADOS DE HETEROARIL-
PIRROLIDINIL- Y -PIPERIDINIL-CETONA".-Clase CO7D
205/04.-Expediente número 09-053.154.-

1. Me refiero a mi Solicitud de Patente de 22 de Mayo de 2009.
2. Debidamente autorizado por mi representado, me permito manifestar a ese Despacho que es deseo del solicitante presentar en forma voluntaria un nuevo capítulo reivindicatorio que reemplaza al originalmente presentado, el cual consta de 21 reivindicaciones. Este capítulo tiene base el capítulo originalmente presentado, sobre el cual se ha eliminado la reivindicación 1 originalmente presentada y en consecuencia se han reenumerado las reivindicaciones restantes, al igual que sus dependencias.

En relación con las anteriores modificaciones, atentamente me permito manifestar a ese Despacho que las mismas **no amplían** de ninguna manera el alcance de la presente invención y que el nuevo capítulo modificado es el que debe ser tenido en cuenta en el trámite de Fase Nacional.

3. Anexo me permito presentar:
 - (a) Formulario único de modificaciones y correcciones;
 - (b) Recibo No. 09-34,261, expedido por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago de la tasa de modificación;

- (c) Copia de las páginas **243** a **249** que corresponden al nuevo capítulo descriptivo y al nuevo capítulo reivindicatorio que consta de **21** reivindicaciones, en las que se han realizado las modificaciones anteriormente mencionadas.
- (d) Nuevos extractos en sus dos formas que reemplazan los originalmente presentados.
4. Ruego a usted tomar atenta nota de lo anterior y proceder de conformidad.

Señor Superintendente,


ALICIA LLOREDA RICAURTE
T.P. 53.215

NOTARIA 41 DEL CÍRCULO DE BOGOTÁ D.C.
DEPARTAMENTO DE CUNDINAMARCA
REPÚBLICA DE COLOMBIA

El Notario 41 del círculo de Bogotá, da fe de que compareció personalmente: 
identificada (o) con:  y tarjeta profesional de abogado No.  del Consejo Superior de la Judicatura, quien autentica la firma puesta por ella (el) mismo en este escrito.
(Art. 84 C. P. C. Decreto. 2282/89 mod. 36)

Bogotá D.C.  4 JUN. 2009


ALICIA LLOREDA RICAURTE
C.C. No. 39.690.713 de Usaquén



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: 6 069701

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 5° Piso

Teléfono: 3 264270

Fax: 6 069701

E-mail: jllcco@lloredacamacho.com

IDENTIFICACION

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Número

TP

④

Número de expediente:09-053.154

⑤

Descripción de la corrección o modificación solicitada Modificación capítulo Reivindicatorio en la solicitud de patente de invención arriba referida.

⑥

Comprobante de pago No. 09-34,261**Fecha** Mayo 11 de 2009

⑦

Anexos:☒

Comprobante de pago de la tasa.

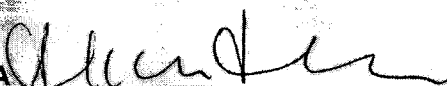
☐

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

53.215

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-053154- -00001-0000

Fecha: 2009-06-08 16:08:17 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 11

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 34,261
FECHA : MAYO 11 DE 2009

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
LLOREDA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	79464464	11/05/2009	19,590,000.00

***** 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

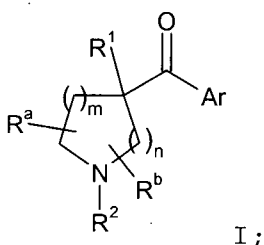
SON: CIENTO ONCE MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la fórmula I:



5 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo,
en la que:

m es un número de 0 a 3;

n es un número de 0 a 2;

Ar es:

- 10 indolilo opcionalmente sustituido;
- indazolilo opcionalmente sustituido;
- azaindolilo opcionalmente sustituido;
- azaindazolilo opcionalmente sustituido;
- 2,3-dihidro-indolilo opcionalmente sustituido;
- 15 1,3-dihidro-indol-2-on-ilo opcionalmente sustituido;
- benzotiofenilo opcionalmente sustituido;
- bencimidazolilo opcionalmente sustituido;
- benzoxazolilo opcionalmente sustituido;
- bencisoxazolilo opcionalmente sustituido;
- 20 benzotiazolilo opcionalmente sustituido;
- bencisotiazolilo opcionalmente sustituido;
- quinolinilo opcionalmente sustituido;
- 1,2,3,4-tetrahydroquinolinilo opcionalmente sustituido;
- quinolin-2-on-ilo opcionalmente sustituido;

isoquinolinilo opcionalmente sustituido;
naftalenilo opcionalmente sustituido;
piridinilo opcionalmente sustituido;
tiofenilo opcionalmente sustituido;

5 R¹ es:

- alquilo C₁₋₆;
- alquenilo C₂₋₆;
- alquinilo C₂₋₆;
- hetero-alquilo C₁₋₆;
- 10 halo-alquilo C₁₋₆;
- halo-alquenilo C₂₋₆;
- cicloalquilo C₃₋₇;
- (cicloalquil C₃₋₇)-alquilo C₁₋₆;
- (alquil C₁₋₆)-(cicloalquil C₃₋₆)-alquilo C₁₋₆;
- 15 alcoxi C₁₋₆;
- alquilsulfonilo C₁₋₆;
- alquilsulfanilo C₁₋₆;
- arilo opcionalmente sustituido;
- heteroarilo opcionalmente sustituido;
- 20 heterociclílico-alquilo C₁₋₆;
- aril-alquilo C₁₋₃, cuya porción arilo está opcionalmente sustituida;
- heteroaril-alquilo C₁₋₃, cuya porción heteroarilo está opcionalmente sustituida;
- 25 ariloxi;
- aril-alcoxi C₁₋₆;
- heteroariloxi; o
- heteroaril-alcoxi C₁₋₆;

R^2 es:

hidrógeno; o

alquilo C_{1-6} ; y

R^a y R^b con independencia entre sí son:

5 hidrógeno;

alquilo C_{1-6} ;

alcoxi C_{1-6} ;

halógeno;

hidroxi; o

10 oxo;

o R^a y R^b forman, juntos, un alquileo C_{1-2} ;

con la condición de que cuando m es 1, n es 2 y Ar es fenilo
opcionalmente sustituido, entonces R^1 no sea metilo ni etilo,
y en donde opcionalmente sustituidos significa uno a cuatro
15 sustituyentes, seleccionados de alquilo, cicloalquilo,
alcoxi, halógeno, haloalquilo, haloalcoxi, ciano, nitro,
heteroalquilo, amino, acilamino, mono-alquilamino, di-
alquilamino, hidroxialquilo, alcoxialquilo, benciloxi,
cicloalquilalquilo, cicloalcoxi, cicloalquilalcoxi,
20 alquilsulfoniloxi, tiofenilo, pirazolilo, piridinilo,
morfolinocarbonilo, $-(CH_2)_q-S(O)_rR^f$; $-(CH_2)_q-NR^gR^h$; $-(CH_2)_q-$
 $C(=O)-NR^gR^h$; $-(CH_2)_q-C(=O)-C(=O)-NR^gR^h$; $-(CH_2)_q-SO_2-NR^gR^h$; $-(CH_2)_q-$
 $N(R^f)-C(=O)-R^i$; $-(CH_2)_q-C(=O)-R^i$; o $-(CH_2)_q-N(R^f)-SO_2-R^g$, donde q
es 0 o 1, r es de 0 a 2, R^f , R^g y R^h cada uno es
25 independientemente hidrógeno o alquilo, y cada R^i es
independientemente hidrógeno, alquilo, hidroxi o alcoxi.

2. El compuesto de la reivindicación 1, en el que Ar es indolilo opcionalmente sustituido.

3. El compuesto de la reivindicación 1, en el que Ar es
5 indazolilo opcionalmente sustituido.

4. El compuesto de la reivindicación 1, en el que Ar es benzotiofenilo opcionalmente sustituido.

10 5. El compuesto de la reivindicación 1, en el que Ar es tiofenilo opcionalmente sustituido.

6. El compuesto de la reivindicación 1, en el que m es
1.
15

7. El compuesto de la reivindicación 1, en el que n es
1.

8. El compuesto de la reivindicación 1, en el que m es
20 2.

9. El compuesto de la reivindicación 1, en el que m es
3.

25 10. El compuesto de la reivindicación 1, en el que n es
2.

11. El compuesto de la reivindicación 1, en el que n es 0.

12. El compuesto de la reivindicación 1, en el que R¹ es:

alquilo C₃₋₆;

aril-alquilo C₁₋₆;

(cicloalquil C₃₋₆)-alquilo C₁₋₆;

hetero-alquilo C₁₋₆;

10 halo-alquilo C₁₋₆; o

(alquil C₁₋₆)-(cicloalquil C₁₋₃)-alquilo C₁₋₆.

13. El compuesto de la reivindicación 1, en el que R¹ es:

15 alquilo C₃₋₆;

(cicloalquil C₃₋₆)-alquilo C₁₋₆; o

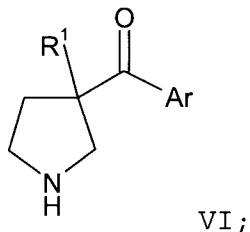
(alquil C₁₋₆)-(cicloalquil C₁₋₃)-alquilo C₁₋₆.

14. El compuesto de la reivindicación 1, en el que R¹ es alquilo C₃₋₆.

15. El compuesto de la reivindicación 1, en el que R² es hidrógeno.

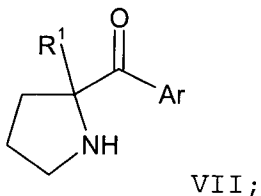
16. El compuesto de la reivindicación 1, en el que R^a y R^b son hidrógeno.

17. El compuesto de la reivindicación 1, en donde dicho compuesto es de la fórmula VI:



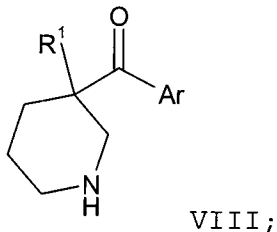
en la que Ar y R¹ tienen los significados definidos en la
5 reivindicación 1.

18. El compuesto de la reivindicación 1, en donde dicho compuesto es de la fórmula VII:



10 en la que Ar y R¹ tienen los significados definidos en la reivindicación 1.

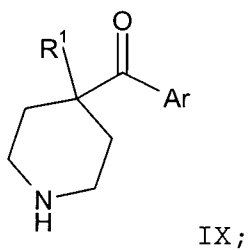
19. El compuesto de la reivindicación 1, en donde dicho compuesto es de la fórmula VIII:



15

en el que Ar y R¹ tienen los significados definidos en la reivindicación 1.

20. El compuesto de la reivindicación 1, en donde dicho compuesto es de la fórmula IX:



en la que Ar y R¹ tienen los significados definidos en la
5 reivindicación 1.

21. Una composición farmacéutica que contiene un compuesto de la reivindicación 1 y un vehículo farmacéutica-mente aceptable.



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

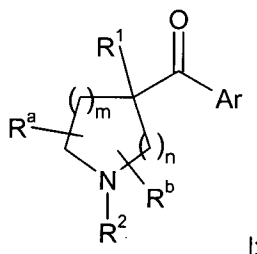
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN
SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION PCT

(21) N° de solicitud: 09-053.154				(51) Int Cl: C07D 205/04	
(22) Fecha de solicitud: 22-05-09				(71) Solicitante(s) F. HOFFMANN-LA ROCHE AG	
(30) Prioridad	(31) No. Prioridad	(32) Fecha	(33) País	(72) Inventor(es) IYER, Pravin; LIN, Clara Jeou Jen; LUCAS, Matthew C. LYNCH, Stephen M.; MADERA, Ann Marie; OZBOYA, Kerem Erol; WEIKERT, Robert James y SCHOENFELD, Ryan Craig.	
	60/875,969	19-12-06	US		
	60/999,561	19-10-07	US		
				(74) Apoderado: ALICIA LLOREDA RICAURTE	
(85) Fecha limite inicio fase nacional: 19-07-09				(87) Publicación internacional	
(86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT				Fecha: 26/06/08	
Fecha de presentación de la solicitud: 11/12/07				N° publicación: WO 2008/074703 A1	
No. de solicitud PCT/EP2007/063736					
(54) Titulo:					
"DERIVADOS DE HETEROARIL-PIRROLIDINIL- Y -PIPERIDINIL-CETONA"					

Resumen - Reivindicación(es):

Reivindicación número 1:

Un compuesto de la fórmula I:



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en la que:

m es un número de 0 a 3;

n es un número de 0 a 2;

Ar es:

indolilo opcionalmente sustituido;
indazolilo opcionalmente sustituido;
azaindolilo opcionalmente sustituido;
azaindazolilo opcionalmente sustituido;
2,3-dihidro-indolilo opcionalmente sustituido;
1,3-dihidro-indol-2-on-ilo opcionalmente sustituido;
benzotiofenilo opcionalmente sustituido;
bencimidazolilo opcionalmente sustituido;
benzoxazolilo opcionalmente sustituido;
bencisoxazolilo opcionalmente sustituido;
benzotiazolilo opcionalmente sustituido;
bencisotiazolilo opcionalmente sustituido;
quinolinilo opcionalmente sustituido;
1,2,3,4-tetrahidroquinolinilo opcionalmente sustituido;
quinolin-2-on-ilo opcionalmente sustituido;
isoquinolinilo opcionalmente sustituido;
naftalenilo opcionalmente sustituido;
piridinilo opcionalmente sustituido;
tiofenilo opcionalmente sustituido;

R¹ es:

alquilo C₁₋₆;
alquenilo C₂₋₆;
alquinilo C₂₋₆;
hetero-alquilo C₁₋₆;
halo-alquilo C₁₋₆;
halo-alquenilo C₂₋₆;

cicloalquilo C₃₋₇;
 (cicloalquil C₃₋₇)-alquilo C₁₋₆;
 (alquil C₁₋₆)-(cicloalquil C₃₋₆)-alquilo C₁₋₆;
 alcoxi C₁₋₆;
 alquilsulfonilo C₁₋₆;
 alquilsulfanilo C₁₋₆;
 arilo opcionalmente sustituido;
 heteroarilo opcionalmente sustituido;
 heterocicilil-alquilo C₁₋₆;
 aril-alquilo C₁₋₃, cuya porción arilo está opcionalmente sustituida;
 heteroaril-alquilo C₁₋₃, cuya porción heteroarilo está opcionalmente sustituida;
 ariloxi;
 aril-alcoxi C₁₋₆;
 heteroariloxi; o
 heteroaril-alcoxi C₁₋₆;

R² es:

hidrógeno; o
 alquilo C₁₋₆; y

R^a y R^b con independencia entre sí son:

hidrógeno;
 alquilo C₁₋₆;
 alcoxi C₁₋₆;
 halógeno;
 hidroxil; o
 oxo;

o R^a y R^b forman, juntos, un alquilenos C₁₋₂;

con la condición de que cuando m es 1, n es 2 y Ar es fenilo opcionalmente sustituido, entonces R¹ no sea metilo ni etilo, y en donde opcionalmente sustituidos significa uno a cuatro sustituyentes, seleccionados de alquilo, cicloalquilo, alcoxi, halógeno, haloalquilo, haloalcoxi, ciano, nitro, heteroalquilo, amino, acilamino, mono-alquilamino, di-alquilamino, hidroxialquilo, alcoxialquilo, benciloxi, cicloalquilalquilo, cicloalcoxi, cicloalquilalcoxi, alquilsulfoniloxi, tiofenilo, pirazolilo, piridinilo, morfolinocarbonilo, -(CH₂)_q-S(O)_r-Rⁱ; -(CH₂)_q-NR^gR^h; -(CH₂)_q-C(=O)-NR^gR^h; -(CH₂)_q-C(=O)-C(=O)-NR^gR^h; -(CH₂)_q-SO₂-NR^gR^h; -(CH₂)_q-N(Rⁱ)-C(=O)-Rⁱ; -(CH₂)_q-C(=O)-Rⁱ; o -(CH₂)_q-N(Rⁱ)-SO₂-R^g, donde q es 0 o 1, r es de 0 a 2, Rⁱ, R^g y R^h cada uno es independientemente hidrógeno o alquilo, y cada Rⁱ es independientemente hidrógeno, alquilo, hidroxil o alcoxi.