



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 14-134660- -00002-0000

Fecha: 2014-07-02 16:33:36 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 608 MODIFICASOLICIT Folios: 12

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES
MODIFICACIONES Y/O CORRECCIONES

1. Identificación del Trámite

- ☐ Error material
- ☒ Patente de Invención
- ☐ Patente de Modelo de Utilidad
- ☐ Registro de Diseño Industrial
- ☐ Esquema de Trazado de Circuitos Integrados
- ☒ Modificación a una Solicitud en trámite

2. Datos del solicitante

Persona Natural ☐ Persona Jurídica ☒

HELSINN HEALTHCARE SA

Nombre o denominación / Nombre o razón social completa

Nombre representante legal

Tipo de empresa Micro ☐ Pequeña ☐ Mediana ☐ Otra ☐

Documento de identificación: ☐ C.C. ☐ C.E. ☐ NIT ☐ Otro Número _____

Nacionalidad/País de constitución	Dirección y domicilio del titular	Ciudad
Suiza	Via Pian Scairolo 9, CH-6912 Lugano/Pazallo, Suiza	Lugano/Pazallo
Dirección electrónica		No. Fax
clientes@cavelier.com		2 11 86 50
		Número telefónico
		3 47 36 11

☐ Autorizo expresamente a la Superintendencia de Industria y Comercio para que todas las comunicaciones sean enviadas a través de la dirección de correo electrónico

3. Datos del apoderado:

Apellidos y Nombre
De Páez Luz Clemencia

Documento de identificación
C.C. 35.456.344

Tarjeta profesional
T.P.A. 23.555

Dirección y domicilio		Ciudad
Carrera 4ª No. 72 –35		Bogotá
Dirección electrónica		No. Fax
cavelier@cavelier.com		2 11 86 50
		Número telefónico
		3 47 36 11
En caso de haber presentado poder general para asuntos que se adelanten ante la Delegatura de Propiedad Industrial, sírvase indicar el número de su radicación o protocolo de poder general		

4. Datos del trámite

Corrección:

Expediente No 14.134.660

Aparece

Debe ser

Modificación:

- ☒ **Modificación al capítulo reivindicatorio.**
Presento nuevo capítulo reivindicatorio compuesto por 19 reivindicaciones y pido respetuosamente que el examen de patentabilidad sea realizado sobre estas nuevas reivindicaciones presentadas. Respetuosamente manifiesto que a pesar de eliminar materia del pliego reivindicatorio originalmente presentado, mi representada no renuncia a la protección que pueda obtener sobre dicha materia y además se reserva el derecho de presentar una solicitud divisional que la contenga durante el trámite de la presente solicitud, beneficiándose de la fecha de prioridad inicialmente reivindicada.
- ☐ **Modificación al capítulo descriptivo.**
- ☐ **Modificación al resumen.**
- ☐ **Modificación a los dibujos.**

5. Anexos

- ☒ Comprobante de pago de la tasa para la presentación de la corrección y/o modificación por \$128.000.
- ☐ Poder, si fuere el caso.
- ☒ Documento que contiene las modificaciones o correcciones.
- ☐ Copia de la solicitud y sus anexos en formato magnético.
- ☒ Comprobante de pago por 9 reivindicaciones adicionales después de la décima reivindicación por \$279.000.

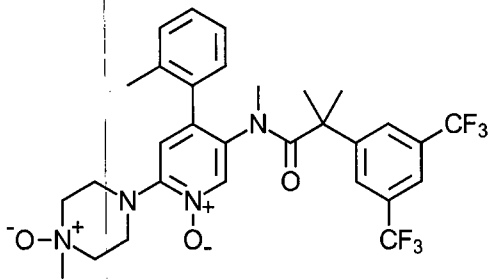
6. Firma	
Nombre y apellidos	Firma
LUZ CLEMENCIA DE PAEZ	
C.C. 35.456.344 DE Usaquén	Tarjeta Profesional 23.555

 MMS\MMS\NCA\ID-AF267794\WPC14871

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto seleccionado del grupo formado por:

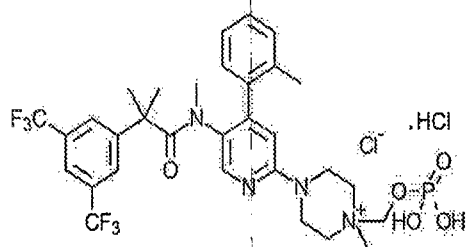
GA 1		4-(5-(2-(3,5-bis(trifluorometil)fenil)-N,2-dimetilpropanamida)-4-(o-tolil)piridin-2-il)-1-metil-1-((fosfonooxi)metil)piperazin-1-io,
GA 2		1-(acetoximetil)-4-(5-(2-(3,5-bis(trifluorometil)fenil)-N,2-dimetilpropanamida)-4-(o-tolil)piridin-2-il)-1-metilpiperazin-1-io,
GA 3		4-(5-(2-(3,5-bis(trifluorometil)fenil)-N,2-dimetilpropanamida)-4-(o-tolil)piridin-2-il)-1-((butiriloxi)metil)-1-metilpiperazin-1-io,
GA 4		1,4-dióxido de 1-(5-(2-(3,5-bis(trifluorometil)fenil)-N,2-dimetilpropanamida)-4-(o-tolil)piridin-2-il)-4-metilpiperazina,

GA 6		1-óxido de 4-(5-(2-(3,5-bis(trifluorometil)fenil)-N,2-dimetilpropanamida)-1-óxido-4-(o-tolil)piridin-2-il)-1-metilpiperazina,
---------	---	---

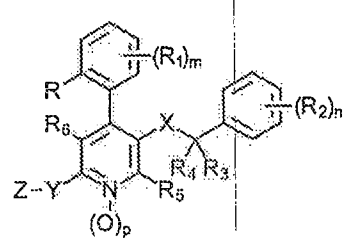
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

- Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, CARACTERIZADO porque se usa en un método para tratar la emesis, disfunción vesical, depresión o ansiedad, en un paciente que lo necesite.
- El compuesto para el uso de acuerdo con la reivindicación 2, CARACTERIZADO porque dicha emesis comprende náuseas y vómitos provocados por la quimioterapia (CINV), náuseas y vómitos provocados por la radioterapia (RINV), o náuseas y vómitos postoperatorios (PONV).
- El compuesto para el uso de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 2 a 3, CARACTERIZADO porque dicha emesis es provocada por quimioterapia moderada o altamente emetogénica.
- El compuesto para el uso de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 2 a 4, CARACTERIZADO porque dicha emesis corresponde a una emesis aguda y tardía provocada por quimioterapia moderada o altamente emetogénica.
- El compuesto para el uso de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 2 a 5, CARACTERIZADO porque dicha disfunción vesicular se selecciona entre urgencia, frecuencia, polaquiuria, nicturia, bajo tiempo de aplazamiento, umbral de volumen sub óptimo, y vejiga neurógena, o una combinación de los mismos.
- El compuesto para el uso de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 2 a 6, CARACTERIZADO porque dicho compuesto, o una sal o aducto farmacéuticamente aceptable del mismo, se administra por una o más de las vías seleccionadas del grupo formado por administración rectal, bucal, sublingual, intravenosa, subcutánea, intradérmica, transdérmica, intraperitoneal, oral, gotas para los ojos, parenteral y tópica.

8. El compuesto para el uso de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 2 a 7, CARACTERIZADO porque dicho compuesto, o una sal o aducto farmacéuticamente aceptable del mismo, se administra por vía intravenosa a una dosis que va desde aproximadamente 10 mg a aproximadamente 200 mg.
9. El compuesto para el uso de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 2 a 8, CARACTERIZADO porque dicha emesis corresponde a emesis aguda o tardía provocada por quimioterapia moderada o altamente emetogénica y que además comprende administrar un antagonista de 5-HT₃ y un corticosteroide.
10. El compuesto para el uso de acuerdo con la reivindicación 9, CARACTERIZADO porque dicho antagonista de 5-HT₃ corresponde a un ondansetrón, palonosetrón, granisetrón o tropisetron, o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma.
11. El compuesto para el uso de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 2 a 10, CARACTERIZADO porque además comprende administrar 2-(3,5-bis(trifluorometil)fenil)-N,2-dimetil-N-(6-(4-metilpiperazin-1-il)-4-(o-tolil)piridin-3-il)propanamida (netupitant).
12. compuesto para el uso de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 2 a 11, CARACTERIZADO porque el sujeto es un humano.
13. Una composición farmacéutica, CARACTERIZADA porque comprende una cantidad terapéuticamente efectiva de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 y uno o más excipientes farmacéuticamente aceptables.
14. El compuesto de la reivindicación 1, como una sal de clorhidrato de cloruro que tiene la siguiente fórmula química:



15. Un proceso de fabricación de un compuesto de fórmula (I):



Fórmula
(I)

Donde:

R se selecciona del grupo formado por hidrógeno, hidroxil, hidroxialquilo, amino, alquilo, alqueno, cicloalquilo, halógeno, alcohalquilo, $-OR^{101}$, $-NR^{101}R^{102}$, $-NR^{101}C(O)R^{102}$, $-C(O)R^{101}$, $-C(O)OR^{101}$, $-C(O)NR^{101}R^{102}$, $-alquilNR^{101}R^{102}$, $-S(O)_2R^{102}$, $-SR^{101}$, $-S(O)_2NR^{101}R^{102}$, arilo, arilalquilo, heterocicloalquilo, heterocicloalquilalquilo, heteroarilo y heteroarilalquilo, cada uno sustituido de manera opcional e independiente con uno o más sustituyentes R^{103} independientes.

R_1 y R_2 se seleccionan independientemente del grupo formado por hidrógeno, hidroxil, hidroxialquilo, amino, alquilo, alqueno, cicloalquilo, halógeno, alcohalquilo, $-OR^{101}$, $-NR^{101}R^{102}$, $-NR^{101}C(O)R^{102}$, $-C(O)R^{101}$, $-C(O)OR^{101}$, $-C(O)NR^{101}R^{102}$, $-alquilNR^{101}R^{102}$, $-S(O)_2R^{102}$, $-SR^{101}$, $-S(O)_2NR^{101}R^{102}$, arilo, arilalquilo, heterocicloalquilo, heterocicloalquilalquilo, heteroarilo y heteroarilalquilo, cada uno sustituido de manera opcional e independiente con uno o más sustituyentes R^{103} independientes; o R_1 , junto con los átomos y/u otros sustituyentes en el mismo anillo fenilo, forman un anillo heterocíclico o carbocíclico, mono, bi o tricíclico, fusionado o no fusionado, que se sustituye de manera opcional e independiente con uno o más sustituyentes R^{103} ; o R_2 , junto con los átomos y/u otros sustituyentes del mismo anillo fenilo, forma un anillo heterocíclico o carbocíclico, mono, bi o tricíclico, fusionado o no fusionado, que se sustituye de manera opcional e independiente con uno o más sustituyentes R^{103} .

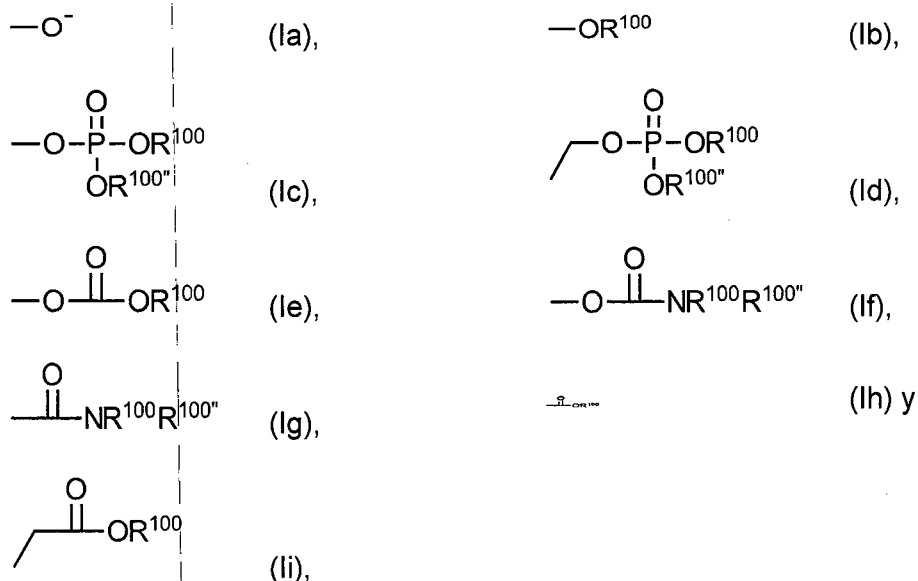
R_3 y R_4 se seleccionan independientemente del grupo formado por hidrógeno, hidroxil, hidroxialquilo, amino, alquilo, alqueno, cicloalquilo, halógeno, alcohalquilo, $-OR^{101}$, $-NR^{101}R^{102}$, $-NR^{101}C(O)R^{102}$, $-C(O)R^{101}$, $-C(O)OR^{101}$, $-C(O)NR^{101}R^{102}$, $-alquilNR^{101}R^{102}$, $-S(O)_2R^{102}$, $-SR^{101}$, $-S(O)_2NR^{101}R^{102}$, arilo, arilalquilo, heterocicloalquilo, heterocicloalquilalquilo, heteroarilo y heteroarilalquilo, cada uno sustituido de manera opcional e independiente con uno o más sustituyentes R^{103} independientes; o R_3 y R_4 , junto con los átomos que conectan el mismo, forman un anillo heterocíclico o carbocíclico, mono, bi o tricíclico, fusionado o no fusionado, que se sustituye de manera opcional e independiente con uno o más sustituyentes R^{103} .

R_5 y R_6 se seleccionan independientemente del grupo formado por hidrógeno, hidroxil, hidroxialquilo, amino, alquilo, alqueno, cicloalquilo, halógeno, alcohalquilo, $-OR^{101}$, $-NR^{101}R^{102}$, $-NR^{101}C(O)R^{102}$, $-C(O)R^{101}$, $-C(O)OR^{101}$, $-C(O)NR^{101}R^{102}$, $-alquilNR^{101}R^{102}$, $-S(O)_2R^{102}$, $-SR^{101}$, $-S(O)_2NR^{101}R^{102}$, arilo, arilalquilo, heterocicloalquilo, heterocicloalquilalquilo, heteroarilo y heteroarilalquilo, cada uno sustituido de manera opcional e independiente con uno o más sustituyentes R^{103} independientes.

X se selecciona del grupo formado por $-C(O)NR^{101}R^{102}$, $-alquilo$, $-alquilNR^{101}R^{102}$, $-NR^{101}C(O)$ y $-NR^{101}alquil$, cada uno sustituido de manera opcional e independiente con uno o más sustituyentes R^{103} independientes.

Y se selecciona del grupo formado por $-NR^{101}R^{102}$, $-NR^{101}alquilOH$, $-NR^{101}S(O)_2alquil$, $-NR^{101}S(O)_2fenil$, $-N=CH-NR^{101}R^{102}$, heterocicloalquilo y heterocicloalquilalquilo, cada uno sustituido de manera opcional e independiente con uno o más sustituyentes R^{103} independientes.

Z corresponde a una fórmula estructural del grupo formado por:



Donde la fórmula (la) se refiere a un óxido.

R^{100} , $R^{100'}$, R^{101} , R^{102} y R^{103} son cada uno independientemente seleccionados del grupo formado por hidrógeno, ciano, $-NO_2$, $-OR^{104}$, óxido, hidroxilo, amino, alquilo, alquenilo, cicloalquilo, halógeno, alcoxi, alcoxialquilo, arilo, arilalquilo, heterocicloalquilo, heterocicloalquilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, $-C(O)R^{104}$, $-C(O)OR^{104}$, $-C(O)NR^{104}R^{105}$, $-NR^{104}R^{105}$, $-NR^{104}S(O)_2R^{105}$, $-NR^{104}C(O)R^{105}$, $-S(O)_2R^{104}$, $-SR^{104}$ y $-S(O)_2NR^{104}R^{105}$, cada uno sustituido de manera opcional e independiente con uno o más sustituyentes R^{103} independientes; o R^{101} , R^{102} , junto con los átomos que conectan el mismo, forman un anillo heterocíclico o carbocíclico, mono, bi o tricíclico, fusionado o no fusionado, que se sustituye de manera opcional e independiente con uno o más sustituyentes R^{103} ; o R^{100} , $R^{100'}$, junto con los átomos que conectan el mismo, forman un anillo heterocíclico o carbocíclico, mono, bi o tricíclico, fusionado o no fusionado, que se sustituye de manera opcional e independiente con uno o más sustituyentes R^{103} .

R^{104} y R^{105} son cada uno independientemente seleccionados del grupo formado por hidrógeno, ciano, $-NO_2$, hidroxilo, óxido, hidroxialquilo, amino, alquilo, alquenilo, cicloalquilo, halógeno, alcoxi, alcoxialquilo, arilo, arilalquilo, heterocicloalquilo, heterocicloalquilalquilo, heteroarilo y heteroarilalquilo.

m es 0, 1, 2, 3 o 4.

n es 0, 1, 2, 3, 4 o 5.

p es 0 o 1.

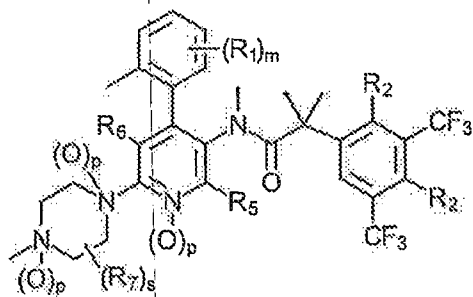
Con la condición de que, si no se cuenta con un N-óxido no de piridina ($N \rightarrow O^+$) en el compuesto de fórmula (I), el número total de N-óxido del compuesto de fórmula (I) es más que uno.

Un proceso que comprende:

- Proporcionar un compuesto de fórmula (I) donde Y corresponde a un grupo de 4-N-metil-piperazina y Z no está presente.
- Proporcionar un fosfato de dialquilo (halometilo).
- Hacer reaccionar un átomo de N del grupo de piperazina con el fosfato de dialquilo (halometilo) a fin de obtener un compuesto cuaternario de fosfato de metileno de amonio.

Donde dicho proceso se realiza a fin de obtener el compuesto GA-1 de acuerdo con la reivindicación 1.

- El proceso de la reivindicación 15, CARACTERIZADO porque se lleva a cabo en presencia de una sal de yoduro y en ausencia de un limpiador de protón.
- El proceso de cualquiera de las reivindicaciones 15 a 16, CARACTERIZADO porque la reacción se lleva a cabo en una significativa ausencia de aire y dioxígeno.
- El proceso de cualquiera de las reivindicaciones 15 a 17, CARACTERIZADO porque el compuesto cuaternario de fosfato de metileno de amonio se obtiene con un grupo (fosfooxi)metilo en forma desalquilada, sin acidificar la reacción ni el producto.
- Un proceso de fabricación de un compuesto de fórmula (V):



Fórmula
(V)

Donde:

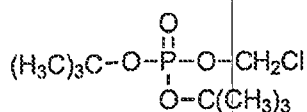
R_7 es seleccionado del grupo seleccionado de hidrógeno, alcoxi, alcoxialquilo, -

OR¹⁰¹, hidroxi, hidroxialquilo, amino, alquilo, alquenilo, cicloalquilo y halógeno, cada uno sustituido de manera opcional e independiente con uno o más sustituyentes R¹⁰³ independientes.

Y todos los demás radicales se definen de acuerdo con la fórmula (I) en la reivindicación 15.

Que comprende:

Poner en contacto un compuesto de fórmula V, CARACTERIZADO porque p es 0 para el átomo de 4-N metilado del anillo piperazinilo, con un compuesto de fórmula VII en presencia de una sal de yoduro, durante un tiempo suficiente para otorgar funcionalidad al átomo de 4-N metilado en el compuesto de fórmula V con el compuesto de fórmula VII y desalquilar el compuesto de fórmula VII:



Formula (VII).

Fórmula
(VII)

Donde dicho proceso se realiza a fin de obtener el compuesto GA-1 de acuerdo con la reivindicación 1.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800.176.089-2

- / -



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 14 - 0066551

Bogotá D.C., Junio 24 de 2014 - 16:26:22

RECIBIDO DE : CAVELIER ABOGADOS

NI 860.041.367

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	644039270	24/06/2014	10.660.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr. UNDITARIO	Vr. CONCEPTO
1	50005-01-03 CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICACIONES	EN CREACION CORRECCION A SOLICITUD EN TRAMITE / MODIFICA	128.000.00	128.000.00
				\$128.000.00

SON: **CIENTO VEINTIOCHO MIL PESOS MONEDA CORRIENTE**

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 14-134660-00002-0000

Fecha: 2014-07-02 16:33:36 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 608 MODIFICASOLICIT Folios: 12

Coto: 14872-841-006-8.

Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C.- Colombia

Web: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Línea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

, Junio 24 de 2014 - 16:26:34

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800.176.089-2

-/-

12



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 14 - 0068373

Bogotá D.C., Julio 01 de 2014 - 11:24:27

RECIBIDO DE : CAVELIER ABOGADOS

NI 860.041.367

RE

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
RECIBO DE CA	999999999	64179	17/06/2014		546.000.00
RECIBO DE CA	999999999	66087	24/06/2014		335.000.00
RECIBO DE CA	999999999	66548	24/06/2014		106.000.00
RECIBO DE CA	999999999	66550	24/06/2014		128.000.00
RECIBO DE CA	999999999	66573	24/06/2014		5.000.00
RECIBO DE CA	999999999	66574	24/06/2014		5.000.00
RECIBO DE CA	999999999	66575	24/06/2014		5.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT. RENTISTICO

9 50005-01-01 SOLICITUDES

CONCEPTO

1607 REIVINDICACION PATENTE UNITARIA
ADICIONAL A LAS 10 INIC

Vr.UNDITARIO

Vr.CONCEPTO

31.000.00

279.000.00

\$279.000.00

SON: **DOSCIENTOS SETENTA Y NUEVE MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable:

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 14-134660-00002-0000

Fecha: 2014-07-02 16:33:36 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 608 MODIFICASOLICIT Folios: 12

Código: 14871-841-006-8

Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C.- Colombia

Web: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Línea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

Julio 1 de 2014 - 11:24:30