

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-126924- -00010-0000

Fecha: 2011-09-15 16:40:39 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 13

FORMULARIO UNICO DE CORRECCION

1. SOLICITUD DE:

☐ Corrección de Error Material ☒ Modificación a una Solicitud

SOLICITANTE	Nombre: EXELIXIS, INC	IDENTIFICACION C.C. ☐ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Cual _____ Número: _____
	Dirección: 220 East Grand Avenue, P.O. Box 511	
	South San Francisco, CA 94083, US Nacionalidad o Domicilio: South Francisco, CA 94083, US Lugar de Constitución: Delaware	
	Teléfono _____ Fax: _____ E-mail: _____	

3. REPRESENTANTE O APODERADO	Nombre: CARLOS ORLANDO MAYA RODRIGUEZ	IDENTIFICACION C.C. ☒ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Cual _____ Número: 17.117.818 TP: 17.402
	Dirección: Cr. 13 A No 28-38, Mz 2	
	Bufete 230. Parque Central Bavaria Teléfono 3419841 Fax: 2-435423 E-mail: carlos.tamayo@tmtamayo.net	

4. Número de expediente: **09-126924**

5. Descripción de la corrección o modificación solicitada: **EN CUANTO A MODIFICACION:**
A LAS REIVINDICACIONES, SIN EXCEDER EL NIVEL INVENTIVO NI LO
EXPUESTO EN LA MEMORIA DESCRIPTIVA.
SE ANEXAN 17 NUEVAS REIVINDICACIONES QUE REEMPLAZAN LAS
PRESENTADAS CON LAS MODIFICACIONES ANTERIORES. CON EL FIN DE QUE
SEAN ESTAS NUEVAS. LAS ANALIZADAS PARA EL EXAMEN DE PATENTABILIDAD.

6. Comprobante de pago No. **11-0090801** Fecha **15 DE SEPT. 2011**

7. Anexos
☒ 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: **CARLOS ORLANDO MAYA RODRIGUEZ** FIRMA:
C.C. **17.117.818** TP **17.402**

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800.176.089-2

- / -



RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0090801

Bogotá D.C., Septiembre 15 de 2011 - 12:15:38

RECIBIDO DE : TM TAMAYO Y ASOCIADOS

NI 830.091.650

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	402980465	15/09/2011	118.000.00

*** 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	118.000.00	118.000.00
				\$118.000.00

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

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-126924- -00010-0000

Fecha: 2011-09-15 16:40:39 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
 Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
 Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 13

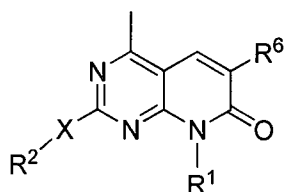
Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C.- Colombia

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

, Septiembre 15 de 2011 - 12:15:38

REIVINDICACIONES

1. Uso de una cantidad terapéuticamente eficaz de un compuesto de Fórmula I (ii):



I(ii)

o un isómero simple de este donde el compuesto está opcionalmente como una sal farmacéuticamente aceptable y en forma adicional opcionalmente como un hidrato y en forma adicional opcionalmente como un solvato de este, caracterizado porque es para la fabricación de un medicamento usado en combinación con uno a más tratamientos seleccionados independientemente de cirugía, uno o más agentes quimioterapéuticos, como rapamicina o un análogo de rapamicina, un agente alquilante, un taxano, un platino, un inhibidor de EGFR, y un inhibidor de ErbB2, una o más de terapias hormonales, uno o más anticuerpos un como anticuerpo EGFR o un anticuerpo ErbB2, , una o más inmunoterapias, terapia de iodo radiactivo, y radiación en el tratamiento del cáncer, en donde el compuesto de Fórmula I(ii) es aquel donde:

R¹ es hidrógeno, alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido, cicloalquilo C₃₋₇ opcionalmente sustituido, heterocicloalquilo opcionalmente sustituido, heterocicloalquilalquilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido o heteroarilalquilo opcionalmente sustituido;

X es -NR³-;

R^2 es hidrógeno o alquilo C_{1-6} donde el alquilo está opcionalmente sustituido con 1, 2, 3 o 4, grupos R^8 ;
 R^3 es hidrógeno;
 R^6 es fenilo, acilo, o heteroarilo donde el fenilo y el heteroarilo están opcionalmente sustituidos con 1, 2, 3 o 4, grupos R^9 ;
 cada R^8 , cuando está presente, es de modo independiente hidroxilo, halo, alcoxi C_{1-6} , o haloalcoxi C_{1-6} ; y
 cada R^9 , cuando está presente, es de modo independiente halo, haloalquilo, haloalcoxi, alquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} , alcoxialquilo C_{1-6} , carboxialquilo C_{1-6} , alcoxycarbonilo, aminoalquilo, cicloalquilo C_{3-7} opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, arilalquilo C_{1-6} , ariloxi, heterocicloalquilo opcionalmente sustituido, o heteroarilo opcionalmente sustituido.

2. Uso del compuesto o isómero simple del mismo de acuerdo con la reivindicación 1 caracterizado porque el cáncer se selecciona de cáncer de mamas, cáncer de colon, cáncer rectal, cáncer de endometrio, tumores carcinoides gastrointestinales, tumores estromales gastrointestinales, glioblastoma, carcinoma hepatocelular, cáncer pulmonar de células pequeñas, cáncer pulmonar de células no pequeñas, melanoma, cáncer ovárico, cáncer cervical, cáncer pancreático, carcinoma prostático, leucemia mielógena aguda, leucemia mielógena crónica, linfoma no Hodgkin, y carcinoma tiroideo

3. Uso del compuesto o isómero simple del mismo de acuerdo con las reivindicaciones 1 o 2 caracterizado porque el tratamiento es un agente quimioterapéutico y el agente quimioterapéutico es un platino.

4. Uso del compuesto o isómero simple del mismo de acuerdo con las reivindicaciones 1 o 2 caracterizado porque el tratamiento es un agente quimioterapéutico y el agente quimioterapéutico es un taxano.

5. Uso del compuesto o isómero simple del mismo de acuerdo con las reivindicaciones 1 o 2 caracterizado porque el tratamiento es un agente quimioterapéutico y el agente quimioterapéutico es rapamicina o un análogo de rapamicina.

6. Uso del compuesto o isómero simple del mismo de acuerdo con las reivindicaciones 1 o 2 caracterizado porque el Compuesto de Fórmula I(ii) se selecciona de:

8-etil-2-(etilamino)-4-metil-6-fenilpirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
6-bifenil-4-il-8-etil-2-(etilamino)-4-metilpirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
6-(2,4-difluorofenil)-8-etil-2-(etilamino)-4-metilpirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
6-(3-cloro-4-fluorofenil)-8-etil-2-(etilamino)-4-metilpirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
8-etil-2-(etilamino)-4-metil-6-[4-(metiloxi)fenil]pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
6-(2,4-diclorofenil)-8-etil-2-(etilamino)-4-metilpirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
6-(3,4-difluorofenil)-8-etil-2-(etilamino)-4-metilpirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
8-etil-2-(etilamino)-4-metil-6-[2-(metiloxi)fenil]pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
8-etil-2-(etilamino)-4-metil-6-[4-(feniloxi)fenil]pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;

6-[2,4-bis(metiloxi)fenil]-8-etil-2-(etilamino)-4-metilpirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
8-etil-2-(etilamino)-6-(3-fluorofenil)-4-metilpirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
8-etil-2-(etilamino)-6-(2-fluorofenil)-4-metilpirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
8-etil-2-(etilamino)-4-metil-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
8-etil-2-(etilamino)-6-(4-fluorofenil)-4-metilpirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
8-etil-2-(etilamino)-4-metil-6-(2-tienil)pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
8-etil-2-(etilamino)-4-metil-6-[3-(metiloxi)fenil]pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
6-(3-clorofenil)-8-etil-2-(etilamino)-4-metilpirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
6-(4-clorofenil)-8-etil-2-(etilamino)-4-metilpirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
8-etil-2-(etilamino)-4-metil-6-(3-tienil)pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
8-etil-2-(etilamino)-4-metil-6-(4-metil-2-tienil)pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
8-etil-2-(etilamino)-4-metil-6-(4-metil-3-tienil)pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
2-[8-etil-2-(etilamino)-4-metil-7-oxo-7,8-dihidropirido[2,3-d]pirimidin-6-il]-1H-pirrol-1-carboxilato de 1,1-dimetiletilo
8-etil-2-(etilamino)-4-metil-6-(1H-pirrol-2-il)pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
6-(5-cloro-2-tienil)-8-etil-2-(etilamino)-4-metilpirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
8-etil-2-(etilamino)-4-metil-6-pirimidin-5-ilpirido[2,3-d]

pirimidin-7(8H)-ona;
8-etil-2-(etilamino)-6-(3-fluoropiridin-4-il)-4-metilpirido [2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
8-etil-2-(etilamino)-6-furan-3-il-4-metilpirido[2,3-d] pirimidin-7(8H)-ona;
8-etil-2-(etilamino)-4-metil-6-[1-(fenilmetil)-1H-pirazol-4- il]pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
2-(etilamino)-4-metil-8-(1-metiletil)-6-(2-tienil)pirido [2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
8-etil-2-(etilamino)-6-(1H-indol-6-il)-4-metilpirido[2,3-d] pirimidin-7(8H)-ona;
8-etil-2-(etilamino)-4-metil-6-(5-fenil-2-tienil)pirido[2,3- d]pirimidin-7(8H)-ona;
2-(etilamino)-6-furan-3-il-4-metil-8-(1-metiletil)pirido [2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
8-etil-2-(etilamino)-4-metil-6-(1H-pirazol-5-il)pirido[2,3- d]pirimidin-7(8H)-ona;
8-ciclohexil-2-(etilamino)-4-metil-6-(2-tienil)pirido[2,3-d] pirimidin-7(8H)-ona;
8-etil-2-(etilamino)-4-metil-6-(1,3-tiazol-2-il)pirido[2,3- d]pirimidin-7(8H)-ona;
8-ciclopentil-2-(etilamino)-4-metil-6-(1H-pirazol-3-il) pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
2-(etilamino)-4-metil-8-(1-metiletil)-6-(1H-pirazol-5- il)pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
8-etil-2-(etilamino)-4-metil-6-(1H-pirazol-1-il)pirido[2,3- d]pirimidin-7(8H)-ona;
2-(etilamino)-4-metil-8-(1-metiletil)-6-(1H-pirazol-1-il) pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
8-ciclopentil-2-(etilamino)-4-metil-6-(1H-pirazol-1-il) pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
8-etil-4-metil-6-(1H-pirazol-5-il)-2-[(2,2,2-trifluoroetil)

amino]pirido[2,3- <i>d</i>]pirimidin-7(8 <i>H</i>)-ona;
2-amino-8-etil-4-metil-6-(1 <i>H</i> -pirazol-5-il)pirido[2,3- <i>d</i>]pirimidin-7(8 <i>H</i>)-ona;
2-(etilamino)-4-metil-6-(1 <i>H</i> -pirazol-3-il)pirido[2,3- <i>d</i>]pirimidin-7(8 <i>H</i>)-ona;
8-etil-4-metil-2-(metilamino)-6-(1 <i>H</i> -pirazol-5-il)pirido[2,3- <i>d</i>]pirimidin-7(8 <i>H</i>)-ona;
2-amino-8-ciclopentil-4-metil-6-(1 <i>H</i> -pirazol-3-il)pirido[2,3- <i>d</i>]pirimidin-7(8 <i>H</i>)-ona;
8-etil-2-[(2-fluoroetil)amino]-4-metil-6-(1 <i>H</i> -pirazol-5-il)pirido[2,3- <i>d</i>]pirimidin-7(8 <i>H</i>)-ona;
2-amino-4-metil-8-(1-metiletil)-6-(1 <i>H</i> -pirazol-3-il)pirido[2,3- <i>d</i>]pirimidin-7(8 <i>H</i>)-ona;
2-amino-4-metil-8-(fenilmetil)-6-(1 <i>H</i> -pirazol-3-il)pirido[2,3- <i>d</i>]pirimidin-7(8 <i>H</i>)-ona;
2-amino-8-etil-4-metil-6-(4-metil-3-tienil)pirido[2,3- <i>d</i>]pirimidin-7(8 <i>H</i>)-ona;
2-amino-8-etil-4-metil-6-(2-tienil)pirido[2,3- <i>d</i>]pirimidin-7(8 <i>H</i>)-ona;
2-amino-8-etil-6-(4-fluorofenil)-4-metilpirido[2,3- <i>d</i>]pirimidin-7(8 <i>H</i>)-ona;
2-amino-8-etil-6-(3-fluorofenil)-4-metilpirido[2,3- <i>d</i>]pirimidin-7(8 <i>H</i>)-ona;
2-amino-8-etil-6-(2-fluorofenil)-4-metilpirido[2,3- <i>d</i>]pirimidin-7(8 <i>H</i>)-ona;
2-amino-8-etil-4-metil-6-(3-tienil)pirido[2,3- <i>d</i>]pirimidin-7(8 <i>H</i>)-ona;
2-amino-8-etil-6-furan-3-il-4-metilpirido[2,3- <i>d</i>]pirimidin-7(8 <i>H</i>)-ona;
2-amino-8-etil-4-metil-6-fenilpirido[2,3- <i>d</i>]pirimidin-7(8 <i>H</i>)-ona;
2-amino-8-etil-4-metil-6-[4-(metiloxi)fenil]pirido[2,3- <i>d</i>]

pirimidin-7(8H)-ona;
2-amino-6-(4-clorofenil)-8-etil-4-metilpirido[2,3-d] pirimidin-7(8H)-ona;
2-amino-6-(3-clorofenil)-8-etil-4-metilpirido[2,3-d] pirimidin-7(8H)-ona;
2-amino-8-etil-6-isoxazol-4-il-4-metilpirido[2,3-d] pirimidin-7(8H)-ona;
2-amino-8-etil-6-furan-2-il-4-metilpirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona;
2-amino-6-(2,4-diclorofenil)-8-etil-4-metilpirido[2,3-d] pirimidin-7(8H)-ona;
5-(2-amino-8-etil-4-metil-7-oxo-7,8-dihidropirido[2,3-d] pirimidin-6-il)tiofeno-2-carbonitrilo
2-amino-8-etil-4-metil-6-pirimidin-5-ilpirido[2,3-d] pirimidin-7(8H)-ona;
2-amino-8-etil-6-(1H-imidazol-5-il)-4-metilpirido[2,3-d] pirimidin-7(8H)-ona;
2-amino-8-etil-4-metil-6-(1H-1,2,3-triazol-5-il)pirido[2,3-d] pirimidin-7(8H)-ona;
2-amino-8-etil-4-metil-6-(1H-pirazol-4-il)pirido[2,3-d] pirimidin-7(8H)-ona;
2-amino-8-etil-4-metil-6-(1,3-tiazol-2-il)pirido[2,3-d] pirimidin-7(8H)-ona;
2-amino-8-etil-4-metil-6-(1H-tetrazol-5-il)pirido[2,3-d] pirimidin-7(8H)-ona;
2-amino-8-etil-4-metil-6-(1-metil-1H-pirrol-2-il)pirido[2,3-d] pirimidin-7(8H)-ona;
2-amino-4,8-dietil-6-(1H-pirazol-5-il)pirido[2,3-d] pirimidin-7(8H)-ona; y
2-amino-8-ciclopentil-4-metil-6-(1,3-tiazol-5-il)pirido[2,3-d] pirimidin-7(8H)-ona;

donde el compuesto está opcionalmente como una sal farmacéuticamente aceptable y en forma adicional y opcional como un hidrato y en forma adicional opcionalmente como un solvato de este.

7. Uso del compuesto o isómero simple del mismo de acuerdo con la reivindicaciones 1, 2, o 6 caracterizado porque el tratamiento es un anticuerpo seleccionado de un anticuerpo EGFR y un anticuerpo ErbB2, o el tratamiento es uno o dos agentes quimioterapéuticos seleccionados de modo independiente de rapamicina, un análogo de rapamicina, un agente alquilante, un taxano, un platino, un inhibidor de EGFR, y un inhibidor de ErbB2.

8. Uso del compuesto o isómero simple del mismo de acuerdo con la reivindicación 7 caracterizado porque el tratamiento es uno o dos agentes quimioterapéuticos seleccionados de modo independiente de rapamicina, paclitaxel, carboplatino, lapatinib, y erlotinib.

9. Uso del compuesto o isómero simple del mismo de acuerdo con la reivindicaciones 1, 2, o 6 caracterizado porque el tratamiento es un agente quimioterapéutico y el agente quimioterapéutico es erlotinib.

10. Uso del compuesto o isómero simple del mismo de acuerdo con la reivindicación 1, 2, o 6 caracterizado porque el tratamiento es un agente quimioterapéutico y el agente quimioterapéutico es lapatinib.

11. Uso del compuesto o isómero simple del mismo de acuerdo con la reivindicación 1, 2, o 6 caracterizado

porque el tratamiento es un agente quimioterapéutico y el agente quimioterapéutico es carboplatino.

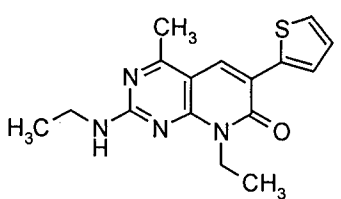
12. Uso del compuesto o isómero simple del mismo de acuerdo con la reivindicación 1, 2, o 6 caracterizado porque el tratamiento es un agente quimioterapéutico y el agente quimioterapéutico es paclitaxel.

13. Uso del compuesto o isómero simple del mismo de acuerdo con la reivindicación 1, 2, o 6 caracterizado porque el tratamiento es un agente quimioterapéutico y el agente quimioterapéutico es rapamicina.

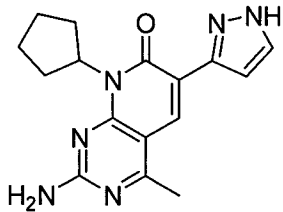
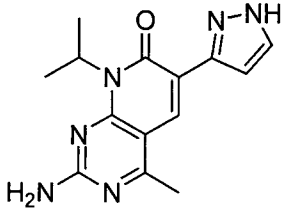
14. Uso del compuesto o isómero simple del mismo de acuerdo con la reivindicación 1, 2, o 6 caracterizado porque el tratamiento es un anticuerpo seleccionado de bevacizumab, trastuzumab, cetuximab, y panitumumab.

15. Uso del compuesto o isómero simple del mismo de acuerdo con la reivindicación 1, 2, o 6 caracterizado porque el tratamiento es un agente quimioterapéutico y el agente quimioterapéutico es temozolomida.

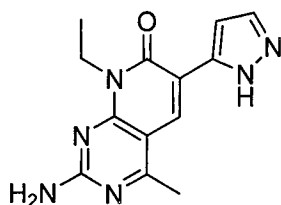
16. Uso del compuesto o isómero simple del mismo de acuerdo con la reivindicación 1 o 2 caracterizado porque el Compuesto de Fórmula I(ii) se selecciona de:

Ejemplo	Estructura	Nombre
18		8-etil-2-(etilamino)-4-metil-6-(2-tienil) pirido [2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona

Ejemplo	Estructura	Nombre
23		8-etil-2-(etilamino)-4-metil-6-(4-metil-2-tienil)pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona
38		8-etil-2-(etilamino)-4-metil-6-(1H-pirazol-5-il)pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona
39		8-ciclohexil-2-(etilamino)-4-metil-6-(2-tienil)pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona
51		2-(etilamino)-4-metil-8-(1-metietil)-6-(1H-pirazol-5-il)pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona
52		8-etil-2-(etilamino)-4-metil-6-(1H-pirazol-1-il)pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona
56		2-amino-8-etil-4-metil-6-(1H-pirazol-5-il)pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona
58		8-etil-4-metil-2-(metilamino)-6-(1H-pirazol-5-il)pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona

Ejemplo	Estructura	Nombre
59		2-amino-8-cyclopentil-4-metil-6-(1 <i>H</i> -pirazol-3-il)pirido[2,3- <i>d</i>]pirimidin-7(8 <i>H</i>)-ona
61		2-amino-4-metil-8-(1-metietil)-6-(1 <i>H</i> -pirazol-3-il)pirido[2,3- <i>d</i>]pirimidin-7(8 <i>H</i>)-ona

17. Uso del compuesto o isómero simple del mismo de acuerdo con la reivindicación 1 o 2 caracterizado porque el Compuesto de Fórmula I(ii) es:



donde el compuesto está opcionalmente como una sal farmacéuticamente aceptable y en forma adicional y opcional como un hidrato y en forma adicional opcionalmente como un solvato de este.