



UNITED STATES PATENT AND TRADEMARK OFFICE

UNDER SECRETARY OF COMMERCE FOR INTELLECTUAL PROPERTY AND
DIRECTOR OF THE UNITED STATES PATENT AND TRADEMARK OFFICE

1 de septiembre de 2017

PTAS

PAMELA GAVETTE

1 DNA WAY

SOUTH SAN FRANCISCO, CA 94080-4990

504528323

OFICINA DE PATENTES Y MARCAS DE ESTADOS UNIDOS
AVISO DE REGISTRO DE DOCUMENTO DE TRASPASO

EL DOCUMENTO ADJUNTO HA SIDO REGISTRADO POR LA SUBDIVISIÓN DE REGISTRO DE TRASPASOS DE LA OFICINA DE PATENTES Y MARCAS DE EE. UU. UNA COPIA COMPLETA ESTÁ DISPONIBLE EN LA SALA DE BÚSQUEDA DE TRASPASOS EN EL NÚMERO DE ROLLO Y MICROFICHA REFERENCIADO ABAJO.

POR FAVOR REVISE TODA LA INFORMACIÓN CONTENIDA EN ESTA NOTIFICACIÓN. LA INFORMACIÓN CONTENIDA EN ESTA NOTIFICACIÓN DE REGISTRO REFLEJA LOS DATOS PRESENTES EN EL SISTEMA DE TRASPASO DE PATENTES Y MARCAS. SI ENCUENTRA ALGÚN ERROR O TIENE PREGUNTAS RELATIVAS A ESTA NOTIFICACIÓN, PUEDE CONTACTARSE CON LA SUBDIVISIÓN DE REGISTRO DE TRASPASOS AL 571-272-3350. POR FAVOR ENVÍE LA SOLICITUD DE CORRECCIÓN A: OFICINA DE PATENTES Y MARCAS DE LOS ESTADOS UNIDOS, PARADA POR CORREO: SUBDIVISIÓN DE REGISTRO DE TRASPASOS, APARTADO POSTAL 1450, ALEXANDRIA, VA 22313.

FECHA DE REGISTRO: 31/08/2017

ROLLO/MICROFICHA: 043461/0376

NÚMERO DE PÁGINAS: 4

DOCUMENTO: TRASPASO DE INTERESES DE CEDENTES (VEA EL DOCUMENTO PARA OBTENER MÁS INFORMACIÓN).

NÚMERO DE EXPEDIENTE: P33832-WO

CEDENTE:

GENENTECH, INC

FECHA DE DOCUMENTACIÓN: 14/08/2017

CESIONARIO:

F. HOFFMANN-LA ROCHE AG

GRENZACHERSTRASSE 124

BASILEA, SUIZA 4070

NÚMERO DE SOLICITUD:

FECHA DE PRESENTACIÓN:

NÚMERO DE PATENTE:

FECHA DE EMISIÓN:

NÚMERO PCT: CN2016098215

TÍTULO:

SUBDIVISIÓN DE REGISTRO DE TRASPASOS

DIVISION DE REGISTROS PÚBLICOS

TRASPASO II (Molécula Pequeña)

GENENTECH, INC. (Cedente), una corporación organizada y existente bajo y en virtud de las leyes del Estado de Delaware, Estados Unidos de América, que tiene su sede principal en South San Francisco, California 94080, Estados Unidos de América, de conformidad con el Exclusivo Acuerdo de Administración de Patentes de EE. UU. del 19 de marzo de 2010, por el presente documento cede a

F. HOFFMANN-LA ROCHE AG (Cesionario)

Grenzacherstrasse 124

4070 Basilea

Suiza

todos sus derechos, títulos e intereses para todos los países del mundo, excepto los Estados Unidos de América y sus territorios y posesiones, en y para la invención descrita y reivindicada en una solicitud titulada

COMPUESTOS 8-(AZETIDÍN-1-IL)-[1,2,4]TRIAZOLO[1,5-A]PIRIDINILO,
COMPOSICIONES Y MÉTODOS DE UTILIZACIÓN DE LOS MISMOS.

para la cual la Solicitud No. PCT/CN2016/098215, presentada el 6 de septiembre de 2016 (Expediente No. P33832-WO), para la cual se ha presentado los Títulos de Patente por

Rongbao HUA, Simon Charles GOODACRE, Mark ZAK, Anthony F. ROMERO, Yun-Xing CHENG y Limin CHENG

así como en cualquier solicitud(es) posterior(es) en todos los países del mundo, excepto los Estados Unidos de América y sus territorios y posesiones, cuya(s) aplicación(es) subsiguiente(s) reclama(n) la Solicitud No. PCT/CN2016/098215 como prioridad.

El Cedente cede expresamente al Cesionario el derecho de presentar solicitud(es) de patente correspondiente(s) en todos los países del mundo, excepto los Estados Unidos de América, y reclamar la fecha de prioridad según cualquier tratado o convención internacional de cualquiera de las solicitudes de patente de EE. UU. anteriores cedidas por el Cedente en este presente Traspaso. El Cedente acepta

ejecutar cualquier traspaso y escritura adicional, así como realizar cualquier acto adicional necesario para que el Cesionario pueda disfrutar de todos los derechos del presente Traspaso.

South San Francisco, California 94080,
Estados Unidos de América

GENENTECH, INC.

Fecha: Agosto 14, 2017

Por: Ilegible

Atulya R. Agarwal, J.D., Ph.D.

Asesor Jurídico

Genentech, Inc.

Signatario Corporativo Autorizado

Basilea, Suiza

F. HOFFMANN-LA ROCHE, AG

Fecha: Basilea, Agosto 17, 2017

Por: Ilegible

Antonio Natioli

Procurador

Susanne Amann

Mandataria

PENDIENTE POR NOTARIZAR

Legalización

El Notario Público abajo firmante del Cantón de Basilea-Ciudad (Suiza), Stefan Schönberger, por medio de la presente legaliza la firma al dorso de

F. Hoffmann-La Roche AG, una sociedad anónima con domicilio legal en Basilea (Suiza), provista por

El señor Antonio Natoli, ciudadano de Basilea (Suiza) y residente en Basilea (Suiza), y la señora Susanne Amann, ciudadana alemana, residente en Heitersheim (Alemania),

ambos debidamente autorizados para firmar documentos en los que la propiedad de la empresa está enajenada.

Firmantes y firmas conocidas personalmente.

Basilea (Suiza), este 18avo (dieciochoavo) día del mes de agosto de 2017 (dos mil diecisiete).



Firma Ilegible

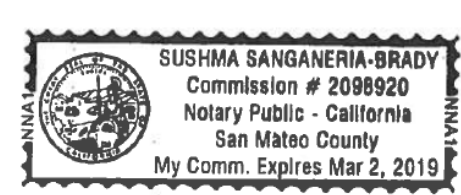
BR 540/2017

RECONOCIMIENTO PARA TODOS LOS EFECTOS LEGALES DE CALIFORNIA
CÓDIGO CIVIL § 1189

Un notario público u otro funcionario que complete este certificado verifica solo la
identidad de la persona que firmó el documento al que se adjunta este certificado,
y no la veracidad, exactitud o validez de ese documento.

Estado de California
Condado de San Mateo

El 14 de agosto 2017 delante de mí, Sushma Sanganeria-Brady, Notario
Público (inserte el nombre y el título del oficial) apareció personalmente Atulya
Agarwal, quien me demostró en base a la evidencia satisfactoria que es la
persona(s) cuyo nombre(s) está(n) suscrito(s) al instrumento adjunto y me reconoció
que él/ ella/ellos ejecutaron el mismo en su/sus capacidad(es) autorizada(s), y que,
mediante su firma(s) en el instrumento, la(s) persona(s), o la entidad en cuyo
nombre la(s) persona(s) actuó(aron), ejecutó(aron) el instrumento.



Certifico bajo PENA DE PERJURIO bajo las
leyes del Estado de California que el párrafo
anterior es verdadero y correcto.

Atestigua mi firma y sello oficial.

Firma: Ilegible
Firma del Notario Público

Coloque el Sello Notarial Arriba

OPCIONAL
Aunque esta sección es opcional, completar esta información puede disuadir la
alteración del documento o re-anexión fraudulenta de este formulario a un
documento no intencionado

Descripción del Documento Adjunto

Título o Tipo de Documento: Fecha de Documento:
Número de Páginas: Otro(s) Firmante(s):

Capacidad(es) Reivindicadas por el(los) Firmante(s)

Nombre del Firmante: Nombre del Firmante:
[] Oficial Corporativo – Título (s): [] Oficial Corporativo – Título (s):
[] Socio – [] Limitado [] General [] Socio – [] Limitado [] General
[] Individual [] Apoderado [] Individual [] Apoderado
[] Fiduciario [] Guardián o Depositario [] Fiduciario [] Guardián o Depositario
[] Otro: [] Otro:
Firmante Representa a: Firmante Representa a:



UNITED STATES PATENT AND TRADEMARK OFFICE

UNDER SECRETARY OF COMMERCE FOR INTELLECTUAL PROPERTY AND
DIRECTOR OF THE UNITED STATES PATENT AND TRADEMARK OFFICE

SEPTEMBER 1, 2017

PTAS

PAMELA GAVETTE
1 DNA WAY
SOUTH SAN FRANCISCO, CA 94080-4990

504528323

UNITED STATES PATENT AND TRADEMARK OFFICE NOTICE OF RECORDATION OF ASSIGNMENT DOCUMENT

THE ENCLOSED DOCUMENT HAS BEEN RECORDED BY THE ASSIGNMENT RECORDATION BRANCH OF THE U.S. PATENT AND TRADEMARK OFFICE. A COMPLETE COPY IS AVAILABLE AT THE ASSIGNMENT SEARCH ROOM ON THE REEL AND FRAME NUMBER REFERENCED BELOW.

PLEASE REVIEW ALL INFORMATION CONTAINED ON THIS NOTICE. THE INFORMATION CONTAINED ON THIS RECORDATION NOTICE REFLECTS THE DATA PRESENT IN THE PATENT AND TRADEMARK ASSIGNMENT SYSTEM. IF YOU SHOULD FIND ANY ERRORS OR HAVE QUESTIONS CONCERNING THIS NOTICE, YOU MAY CONTACT THE ASSIGNMENT RECORDATION BRANCH AT 571-272-3350. PLEASE SEND REQUEST FOR CORRECTION TO: U.S. PATENT AND TRADEMARK OFFICE, MAIL STOP: ASSIGNMENT RECORDATION BRANCH, P.O. BOX 1450, ALEXANDRIA, VA 22313.

RECORDATION DATE: 08/31/2017

REEL/FRAME: 043462/0376
NUMBER OF PAGES: 4

BRIEF: ASSIGNMENT OF ASSIGNORS INTEREST (SEE DOCUMENT FOR DETAILS).

DOCKET NUMBER: P33832-WO

ASSIGNOR:
GENENTECH, INC.

DOC DATE: 08/14/2017

ASSIGNEE:
F. HOFFMANN-LA ROCHE AG
GRENZACHERSTRASSE 124
BASEL, SWITZERLAND 4070

APPLICATION NUMBER:
PATENT NUMBER:
PCT NUMBER: CN2016098215
TITLE:

FILING DATE:
ISSUE DATE:

ASSIGNMENT RECORDATION BRANCH
PUBLIC RECORDS DIVISION

ASSIGNMENT II (Small Molecule)

GENENTECH, INC. (Assignor), a corporation organized and existing under and by virtue of the laws of the State of Delaware, United States of America, having its principal place of business at South San Francisco, California 94080, United States of America, pursuant to the 19 March 2010 Ex-US Patent Administration Agreement, hereby assigns to

F. HOFFMANN-LA ROCHE AG (Assignee)
Grenzacherstrasse 124
4070 Basel
Switzerland

all of its right, title and interest for all countries of the world except the United States of America and its territories and possessions, in and to the invention described and claimed in an application entitled

8-(AZETIDIN-1-YL)-[1,2,4]TRIAZOLO[1,5-A] PYRIDINYL COMPOUNDS, COMPOSITIONS AND METHODS OF USE THEREOF

for which Application No. PCT/CN2016/098215 filed on 6 September 2016 (Docket No. P33832-WO) for which Letters Patent have been filed by

Rongbao HUA, Simon Charles GOODACRE, Mark ZAK, Anthony F. ROMERO, Yun-Xing CHENG and Limin CHENG

as well as in any subsequent application(s) in all countries of the world, except the United States of America and its territories and possessions, which subsequent application(s) claim Application No. PCT/CN2016/098215 as priority.

Assignor expressly assigns to Assignee the right to file corresponding patent application(s) in all countries of the world except the United States of America and to claim the priority date under any international treaty or convention of any of the above U.S. patent application(s) assigned by Assignor in this present Assignment. Assignor agrees to execute any additional assignments and writings as well as to perform any additional acts necessary to enable Assignee to enjoy the full rights of the present Assignment.

South San Francisco, California 94080,
United States of America

GENENTECH, INC.

Date: August 14, 2017

By: 

Atulya R. Agarwal, J.D., Ph.D.
Associate General Counsel

F. HOFFMANN-LA ROCHE AG

Authorized Corporate Signatory

Basel, Switzerland

Date: Basel, August 17, 2017

By:  

Antonio Natoli
Holder of procuration

Susanne Amann
Mandatory

TO BE NOTARIZED

Legalization

The undersigned Notary Public of the Canton of Basel-Stadt (Switzerland), Stefan Schönberger, herewith legalizes the overleaf signature of

F. Hoffmann-La Roche AG, a stock company with legal domicile in Basel (Switzerland), rendered by

Mister Antonio Natoli, citizen of and residing in Basel (Switzerland), and

Miss Susanne Amann, German citizen, residing in Heitersheim (Germany),

both duly entitled to sign documents wherein property of the company is alienated.

Signers and signatures personally known.

B a s e l (Switzerland), this 18th (eighteenth) day of August 2017 (two thousand and seventeen).



BR 540/2017

CALIFORNIA ALL-PURPOSE ACKNOWLEDGMENT

CIVIL CODE § 1189

A notary public or other officer completing this certificate verifies only the identity of the individual who signed the document to which this certificate is attached, and not the truthfulness, accuracy, or validity of that document.

State of California)

County of SAN MATEO)On AUGUST 14, 2017 before me, SUSHMA SANGANERIA-BRADY, NOTARY PUBLIC

Date

Here Insert Name and Title of the Officer

personally appeared

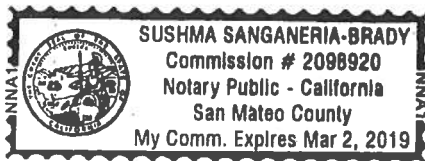
ATULYA AGARWAL

Name(s) of Signer(s).

who proved to me on the basis of satisfactory evidence to be the person(s) whose name(s) is/are subscribed to the within instrument and acknowledged to me that he/she/they executed the same in his/her/their authorized capacity(ies), and that by his/her/their signature(s) on the instrument the person(s), or the entity upon behalf of which the person(s) acted, executed the instrument.

I certify under PENALTY OF PERJURY under the laws of the State of California that the foregoing paragraph is true and correct.

WITNESS my hand and official seal.



Signature

Sushma Sanganeria-Brady
Signature of Notary Public

Place Notary Seal Above

OPTIONAL

Though this section is optional, completing this information can deter alteration of the document or fraudulent reattachment of this form to an unintended document.

Description of Attached Document

Title or Type of Document: _____ Document Date: _____

Number of Pages: _____ Signer(s) Other Than Named Above: _____

Capacity(ies) Claimed by Signer(s)

Signer's Name: _____

☐ Corporate Officer — Title(s): _____☐ Partner — ☐ Limited ☐ General☐ Individual ☐ Attorney in Fact☐ Trustee ☐ Guardian or Conservator☐ Other: _____

Signer Is Representing: _____

Signer's Name: _____

☐ Corporate Officer — Title(s): _____☐ Partner — ☐ Limited ☐ General☐ Individual ☐ Attorney in Fact☐ Trustee ☐ Guardian or Conservator☐ Other: _____

Signer Is Representing: _____

(12) International Application Status Report

Received at International Bureau: 07 September 2017 (07.09.2017)

Information valid as of: 09 November 2017 (09.11.2017)

Report generated on: 03 May 2019
(03.05.2019)

(10) Publication number:
WO 2018/046409

(43) Publication date:
15 March 2018 (15.03.2018)

(26) Publication language:
English (EN)

(21) Application number:
PCT/EP2017/072034

(22) Filing date:
02 September 2017 (02.09.2017)

(25) Filing language:
English (EN)

(31) Priority number(s):
PCT/CN2016/098215 (CN)

(32) Priority date(s):
06 September 2016 (06.09.2016)

(33) Priority status:
Priority document received (in compliance with PCT Rule 17.1)

(51) International Patent Classification:
C07D 471/04 (2006.01); *A61K 31/437* (2006.01); *A61P 29/00* (2006.01)

(71) Applicant(s):

F. HOFFMANN-LA ROCHE AG [CH/CH]; Grenzacherstrasse 124 4070 Basel (CH) (*for all designated states except US*)
GENENTECH, INC. [US/US]; 1 DNA Way South San Francisco, California 94080 (US) (*US only*)

(72) Inventor(s):

GOODACRE, Simon Charles; 8/9 Spire Green Centre Flex Meadow Harlow Essex CM195TR (GB)
ZAK, Mark; c/o Genentech, Inc. 1 DNA Way South San Francisco, California 94080 (US)
ROMERO, F. Anthony; c/o Genentech, Inc. 1 DNA Way South San Francisco, California 94080 (US)
CHENG, Yun-Xing; 6 Tai-he Road BDA Beijing 100176 (CN)
CHENG, Limin; 6 Tai-he Road BDA Beijing 100176 (CN)
HUA, Rongbao; 6 Tai-he Road BDA Beijing 100176 (CN)

(74) Agent(s):

SCHIRLIN, Julien; Grenzacherstrasse 124 4070 Basel (CH)

(54) Title (EN): 8-(AZETIDIN-1-YL)-[1,2,4]TRIAZOLO[1,5-A]PYRIDINYL COMPOUNDS, COMPOSITIONS AND METHODS OF USE THEREOF

(54) Title (FR): COMPOSÉS DE 8-(AZÉTIDIN-1-YL)-[1,2,4]TRIAZOLO[1,5-A]PYRIDINYLE, COMPOSITIONS ET PROCÉDÉS D'UTILISATION DE CEUX-CI

(57) Abstract:

(EN): Compounds of Formula (I) and (II), or a stereoisomer, tautomer, solvate, prodrug or salt thereof, and methods of use as Janus kinase inhibitors are described herein.

(FR): L'invention concerne des composés de formule (I) et (II), ou un stéréoisomère, un tautomère, un solvate, un promédicament ou un sel de ceux-ci, et des procédés d'utilisation en tant qu'inhibiteurs de Janus kinase.

International search report:

Received at International Bureau: 06 November 2017 (06.11.2017) [EP]

International Report on Patentability (IPRP) Chapter II of the PCT:

Not available

(81) Designated States:

AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW
European Patent Office (EPO) : AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR
African Intellectual Property Organization (OAPI) : BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG

African Regional Intellectual Property Organization (ARIPO) : BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW
Eurasian Patent Organization (EAPO) : AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM

Declarations:

Declaration made as applicant's entitlement, as at the international filing date, to apply for and be granted a patent (Rules 4.17(ii) and 51bis.1(a)(ii)), in a case where the declaration under Rule 4.17(iv) is not appropriate

Declaration made as applicant's entitlement, as at the international filing date, to claim the priority of the earlier application, where the applicant is not the applicant who filed the earlier application or where the applicant's name has changed since the filing of the earlier application (Rules 4.17(iii) and 51bis.1(a)(iii))

Declaration of inventorship (Rules 4.17(iv) and 51bis.1(a)(iv)) for the purposes of the designation of the United States of America

TRATADO DE COOPERACIÓN DE PATENTES

En referencia de Solicitud de: F. HOFFMANN-LA ROCHE AG *et al.*

Solicitud internacional No. PCT/EP2017/072034

Fecha de Presentación Internacional: 02 de septiembre de 2017

Título: COMPUESTOS DE 8-(AZETIDIN-1-IL)-
[1,2,4]TRIAZOLO[1,5-A]PIRIDINIL,
COMPOSICIONES Y MÉTODOS DE USO
DE LOS MISMOS

Ref. del Expediente del Solicitante: P33832-WO-1

VIA ePCT

Oficina Internacional de la OMPI
34, chemin des Colombettes
Casillero de Apartado de Correos 18
1211 Ginebra 20, Suiza

COMUNICACIÓN EN VIRTUD DE Regla 92bis

Estimado Señor/Señora:

De acuerdo con la Regla 92bis, los Solicitantes respetuosamente solicitan el registro de los siguientes cambios a la solicitud de patente internacional mencionada anteriormente:

- Designar a F. HOFFMANN-LA ROCHE AG como Solicitante para TODOS los Estados designados, excepto los Estados Unidos de América
- Designar a GENENTECH, INC. como Solicitante únicamente para los Estados Unidos de América

Los solicitantes debidamente esperan las Notificaciones del Registro de estos Cambios (PCT/IB/306).

Por favor, no dude en ponerse en contacto con el suscrito con cualquier pregunta.

Respetuosamente,

F. HOFFMANN-LA ROCHE AG

/Julien Schirlin/

Octubre 4, 2017

Julien Schirlin

Registro de Agente No.: 223630.5

PATENT COOPERATION TREATY

In re Application of: F. HOFFMANN-LA ROCHE AG *et al.*

International Application No. PCT/EP2017/072034

International Filing Date: 02 September 2017

Title: 8-(AZETIDIN-1-YL)-[1,2,4]TRIAZOLO[1,5-A] PYRIDINYL
COMPOUNDS, COMPOSITIONS AND METHODS OF USE
THEREOF

Applicant file reference: P33832-WO-1

VIA ePCT

International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
P.O. Box 18
1211 Geneva 20, Switzerland

COMMUNICATION UNDER Rule 92bis

Dear Sir/Madam:

Pursuant to Rule 92bis, Applicants respectfully request the recordation of the following changes to the above-referenced international patent application:

- Designate F. HOFFMANN-LA ROCHE AG as an Applicant for ALL designated States except the United States of America
- Designate GENENTECH, INC. as an Applicant for the United States of America only

Applicants respectfully await the Notifications of the Recording of these Changes (PCT/IB/306).

Please do not hesitate to contact the undersigned with any questions.

Respectfully submitted,

F. HOFFMANN-LA ROCHE AG

/Julien Schirlin/

Julien Schirlin

Agent Registration No.: 223630.5

October 4, 2017

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

Re: PI.-F. HOFFMANN-LA ROCHE AG.-Solicitud de Patente de Invención en Fase Nacional PCT para "COMPUESTOS 8-(AZETIDÍN-1-IL)-[1,2,4]TRIAZOLO[1,5-A]PIRIDINILO, COMPOSICIONES Y MÉTODOS DE UTILIZACIÓN DE LOS MISMOS." Clase **C07D 471/04.-Expediente número **NC2019/0002171.****

Por medio del presente, hago referencia al Auto No. 990 dictado por este Despacho y notificado por fijación en lista el 13 de marzo de 2019. Con el fin de dar respuesta al Auto emitido por la División de Nuevas Creaciones, a continuación expongo lo siguiente:

1. Petitorio (Art. 26 D486 literal a)

En la solicitud arriba mencionada aparece como solicitante F. HOFFMANN-LA ROCHE AG conforme al documento de cesión emitido por la Oficina de Patentes y Marcas de Estados Unidos y lo reflejado en PATENTSCOPE.

Por lo anterior, GENENTECH, INC cedió todos los derechos a F. HOFFMANN-LA ROCHE AG para presentar la solicitud de patente en todos los países del mundo excepto los Estados Unidos de América.

2. Cesión (Art. 26 D486 literal k)

De acuerdo a los requisitos PCT para la entrada en fase nacional, en virtud de la Regla 51bis, nos permitimos informarle que está la declaración bajo la regla 4.17 ii, disponible en PATENTSCOPE, que nos exime de presentar el documento de cesión de inventores solicitado.

3. Modificaciones voluntarias

Adicionalmente, me permito manifestar a este Despacho que es deseo del solicitante **eliminar** las reivindicaciones 27 a 35 del capítulo reivindicatorio presentado originalmente, de tal manera que el capítulo reivindicatorio modificado pasa a estar conformado por **26 reivindicaciones.**

4. Anexo al presente memorial, me permito presentar los siguientes documentos:
- (a) Copia del documento de asignación de Genentech, Inc. a F. Hoffman-La Roche AG, versión Español e Inglés.
 - (b) Copia del documento PCT en virtud de la regla 92Bis, versión Español e Inglés.
 - (c) Copia del Informe del estado de la solicitud internacional disponible en PATENTSCOPE.
 - (d) Copia de la páginas **180 a 185** que corresponden al capítulo reivindicatorio modificado que consta de **26 reivindicaciones** y que reemplaza al originalmente presentado.
5. Adicionalmente, me permito informar que el pago correspondiente a las reivindicaciones adicionales **11 a 26**, se realizó a través de la plataforma SIPI el día de hoy.
6. Ruego a usted tomar atenta nota de lo anterior y proceder de conformidad.

Señor Superintendente,



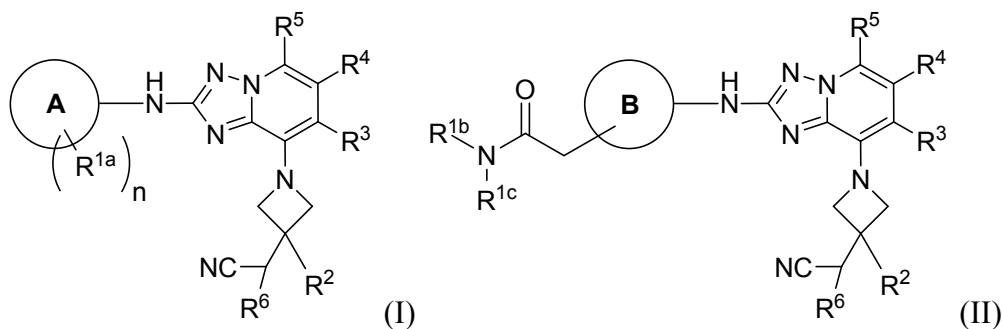
ALICIA LLORED A RICAURTE

T.P. 53.215

Direcciones para Notificación: notificacionesip@lloredacamacho.com
notificacionespatentes@lloredacamacho.com

REIVINDICACIONES

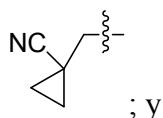
1. Un compuesto de fórmula (I) o (II):



- 5 o un estereoisómero, tautómero, solvato, profármaco o sal del mismo, en el que:
 el anillo A es fenilo, piridinilo, pirazolilo o isoquinolinilo;
 el anillo B es fenilo o heteroarilo de 5-6 elementos;
 n es 0, 1 ó 2,
 R² se selecciona de:
- 10 (i) $-(\text{alquileo } C_0-C_6)-R^c$,
 (ii) $-C(O)-NH-(\text{alquilo } C_1-C_6 \text{ sustituido opcionalmente con halógeno, OH o CN})$ o
 (iii) $-C(O)-(\text{azetidino sustituido opcionalmente con alquilo } C_1-C_6 \text{ o haloalquilo } C_1-C_6)$,
- 15 R³, R⁴ y R⁵ se seleccionan, cada uno independientemente, del grupo que consiste en hidrógeno, CH₃, CH₂CH₃, OCH₃, CF₃, F y Cl,
 R⁶ es H o alquilo C₁-C₃,
 R^{1a} independientemente en cada aparición es halógeno, alquilo C₁-C₆ sustituido
 opcionalmente con halógeno, CN o OH, alcoxi C₁-C₆, cicloalquilo de 3 a 10
 20 elementos, heterocicloalquilo de 3 a 10 elementos, $-C(O)-NR^aR^b$, $-C(O)-$
 (heterocicloalquilo de 3 a 10 elementos sustituido opcionalmente con alquilo C₁-C₆,
 heterocicloalquilo de 3 a 7 elementos o $-C(O)-(\text{heterocicloalquilo de 3 a 7 elementos sustituido opcionalmente con alquilo } C_1-C_6)$,
 R^{1b} y R^{1c} juntos forman un heterocicloalquilo de 3 a 10 elementos sustituido
 25 opcionalmente con alquilo C₁-C₆ sustituido opcionalmente con halógeno, CN, OH o

alcoxi C₁-C₆, -(alquileo C₀-C₆)-(heterocicloalquilo de 3 a 7 elementos sustituido opcionalmente con alquilo C₁-C₆, -C(O)-(alquilo C₁-C₆), -C(O)O-(alquilo C₁-C₆) o -(alquileo C₀-C₆)-C(O)-NR^aR^b) o -(alquileo C₀-C₆)-NR^aR^b;

R^a y R^b se seleccionan independientemente de un grupo que consiste en hidrógeno, -alquilo C₁-C₆ sustituido opcionalmente con halógeno, OH, CN o alcoxi C₁-C₆, -C(O)-(alquileo C₁-C₆)-(cicloalquilo de 3 a 10 elementos), -(alquileo C₀-C₆)-(heteroarilo de 5-6 elementos sustituido opcionalmente con alquilo C₁-C₆), -(alquileo C₀-C₆)-(heterocicloalquilo de 3 a 7 elementos sustituido opcionalmente con alquilo C₁-C₆ o heterocicloalquilo de 3 a 7 elementos) y



R^c es cicloalquilo de 3 a 10 elementos, heterocicloalquilo de 3 a 10 elementos, fenilo o heteroarilo de 5-6 elementos, en el que R^c se sustituye opcionalmente con halógeno, CN, OH, alquilo C₁-C₆ sustituido opcionalmente con halógeno, OH, CN, alcoxi C₁-C₆ o tioalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ sustituido opcionalmente con halógeno, tioalquilo C₁-C₆ sustituido opcionalmente con halógeno, -(alquileo C₀-C₆)-NR^aR^b, -(alquileo C₀-C₆)-cicloalquilo de 3 a 7 elementos, -(alquileo C₀-C₆)-(heterocicloalquilo de 3 a 10 elementos sustituido opcionalmente con halógeno, OH, CN, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆), -(alquileo C₀-C₆)-(fenilo sustituido opcionalmente con halógeno, OH, CN, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆) o -(alquileo C₀-C₆)-(heteroarilo de 5-6 elementos sustituido opcionalmente con halógeno, OH, CN, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆).

2. El compuesto según la reivindicación 1, definido adicionalmente como un compuesto de fórmula (I) o un estereoisómero, tautómero, solvato, profármaco o sal del mismo.

3. El compuesto según la reivindicación 1 o la reivindicación 2, en el que R² es -C(O)-NH-(alquilo C₁-C₆ sustituido opcionalmente con halógeno, OH o CN) o -C(O)-(azetidino sustituido opcionalmente con alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆).

4. El compuesto según la reivindicación 1 o la reivindicación 2, en el que R² es -(alquileo C₀-C₆)-R^c.

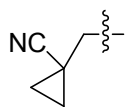
5. El compuesto según la reivindicación 4, en el que R^c es cicloalquilo de 3 a 10 elementos, heterocicloalquilo de 3 a 10 elementos o fenilo, en el que R^c se sustituye opcionalmente con halógeno, CN, OH, alquilo C_1-C_6 sustituido opcionalmente con halógeno, OH, CN, alcoxi C_1-C_6 o tioalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 sustituido opcionalmente con halógeno, tioalquilo C_1-C_6 sustituido opcionalmente con halógeno, $-(alquileo\ C_0-C_6)-NR^aR^b$, $-(alquileo\ C_0-C_6)-cicloalquilo$ de 3 a 7 elementos, $-(alquileo\ C_0-C_6)-(heterocicloalquilo$ de 3 a 10 elementos sustituido opcionalmente con halógeno, OH, CN, alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6), $-(alquileo\ C_0-C_6)-(fenilo$ sustituido opcionalmente con halógeno, OH, CN, alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6) o $-(alquileo\ C_0-C_6)-(heteroarilo$ de 5-6 elementos sustituido opcionalmente con halógeno, OH, CN, alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6).
6. El compuesto según la reivindicación 4, en el que R^c es heteroarilo de 5-6 elementos sustituido opcionalmente con halógeno, CN, OH, alcoxi C_1-C_6 sustituido opcionalmente con halógeno, CN, OH, alquilo C_1-C_6 sustituido opcionalmente con halógeno, OH, CN, alcoxi C_1-C_6 o tioalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 sustituido opcionalmente con halógeno, tioalquilo C_1-C_6 sustituido opcionalmente con halógeno, $-(alquileo\ C_0-C_6)-NR^aR^b$, $-(alquileo\ C_0-C_6)-cicloalquilo$ de 3 a 7 elementos, $-(alquileo\ C_0-C_6)-(heterocicloalquilo$ de 3 a 10 elementos sustituido opcionalmente con halógeno, OH, CN, alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6), $-(alquileo\ C_0-C_6)-(fenilo$ sustituido opcionalmente con halógeno, OH, CN, alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6) o $-(alquileo\ C_0-C_6)-(heteroarilo$ de 5-6 elementos sustituido opcionalmente con halógeno, OH, CN, alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6).
7. El compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en el que n es 0.
8. El compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en el que n es 1 y R^{1a} es halógeno, alquilo C_1-C_6 sustituido opcionalmente con halógeno, CN o OH, alcoxi C_1-C_6 , cicloalquilo de 3 a 10 elementos, heterocicloalquilo de 3 a 10 elementos, $-C(O)-NR^aR^b$, $-C(O)-(heterocicloalquilo$ de 3 a 10 elementos sustituido opcionalmente con alquilo C_1-C_6 , heterocicloalquilo de 3 a 7 elementos o $-C(O)-(heterocicloalquilo$ de 3 a 7 elementos sustituido opcionalmente con alquilo C_1-C_6);

9. El compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, en el que n es 1 y R^{1a} , independientemente en cada aparición, es halógeno, alquilo C_1-C_6 sustituido opcionalmente con halógeno, CN o OH, alcoxi C_1-C_6 , cicloalquilo de 3 a 10 elementos o heterocicloalquilo de 3 a 10 elementos.

5

10. El compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, en el que R^a es hidrógeno o alquilo C_1-C_3 , y R^b es -alquilo C_1-C_6 sustituido opcionalmente con halógeno, OH, CN o alcoxi C_1-C_6 , -C(O)-(alquilenos C_1-C_6)-(cicloalquilo de 3 a 10 elementos), -(alquilén C_0-C_6)-(heteroarilo de 5-6 elementos sustituido opcionalmente con alquilo C_1-C_6), -(alquilén C_0-C_6)-(heterocicloalquilo de 3 a 7 elementos sustituido opcionalmente con alquilo C_1-C_6 o heterocicloalquilo de 3 a 7 elementos) o

10



11. El compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, en el que el Anillo A es fenilo, piridinilo o pirazolilo.

15

12. El compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11, en el que el Anillo A es pirazolilo.

13. El compuesto según la reivindicación 1, definido adicionalmente como un compuesto de fórmula (II) o un estereoisómero, tautómero, solvato, profármaco o sal del mismo.

20

14. El compuesto según la reivindicación 1 o la reivindicación 13, en el que R^2 es -C(O)-NH-(alquilo C_1-C_6 sustituido opcionalmente con halógeno, OH o CN) o -C(O)-(azetidinilo sustituido opcionalmente con alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6).

25

15. El compuesto según la reivindicación 13, en el que R^2 es -(alquilenos C_0-C_6)- R^c .

16. El compuesto según la reivindicación 15, en el que R^c es cicloalquilo de 3 a 10 elementos, heterocicloalquilo de 3 a 10 elementos o fenilo, en el que R^c se sustituye opcionalmente con halógeno, CN, OH, alquilo C_1-C_6 sustituido

- opcionalmente con halógeno, OH, CN, alcoxi C₁-C₆ o tioalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ sustituido opcionalmente con halógeno, tioalquilo C₁-C₆ sustituido opcionalmente con halógeno, -(alquileo C₀-C₆)-NR^aR^b, -(alquileo C₀-C₆)-cicloalquilo de 3 a 7 elementos, -(alquileo C₀-C₆)-(heterocicloalquilo de 3 a 10 elementos sustituido opcionalmente con halógeno, OH, CN, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆), -(alquileo C₀-C₆)-(fenilo sustituido opcionalmente con halógeno, OH, CN, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆) o -(alquileo C₀-C₆)-(heteroarilo de 5-6 elementos sustituido opcionalmente con halógeno, OH, CN, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆).
- 10 17. El compuesto según la reivindicación 15, en el que R^c es heteroarilo de 5-6 elementos sustituido opcionalmente con halógeno, CN, OH, alcoxi C₁-C₆ sustituido opcionalmente con halógeno, CN, OH, alquilo C₁-C₆ sustituido opcionalmente con halógeno, OH, CN, alcoxi C₁-C₆ o tioalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ sustituido opcionalmente con halógeno, tioalquilo C₁-C₆ sustituido
- 15 opcionalmente con halógeno, -(alquileo C₀-C₆)-NR^aR^b, -(alquileo C₀-C₆)-cicloalquilo de 3 a 7 elementos, -(alquileo C₀-C₆)-(heterocicloalquilo de 3 a 10 elementos sustituido opcionalmente con halógeno, OH, CN, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆), -(alquileo C₀-C₆)-(fenilo sustituido opcionalmente con halógeno, OH, CN, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆) o -(alquileo C₀-C₆)-
- 20 (heteroarilo de 5-6 elementos sustituido opcionalmente con halógeno, OH, CN, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆).
18. El compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 y 14 a 17, en el que R^{1b} y R^{1c} juntos forman un heterocicloalquilo de 3 a 10 elementos sustituido
- 25 opcionalmente con alquilo C₁-C₆ sustituido opcionalmente con halógeno, CN, OH o alcoxi C₁-C₆, -(alquilén C₀-C₆)-(heterocicloalquilo de 3 a 7 elementos sustituido opcionalmente con alquilo C₁-C₆, -C(O)-(alquilo C₁-C₆), -C(O)O-(alquilo C₁-C₆) o -(alquilén C₀-C₆)-C(O)-NR^aR^b), -(alquilén C₀-C₆)-NR^aR^b o -C(O)-
- (heterocicloalquilo de 3 a 7 elementos sustituido opcionalmente con alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆).
- 30 19. El compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 y 14 a 18, en el que el Anillo B es fenilo.

20. El compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 y 14 a 18, en el que el Anillo B es heteroarilo de 5-6 elementos.
21. El compuesto según la reivindicación 20, en el que el Anillo B es pirazolilo.
22. El compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21, en el que R³, R⁴ y R⁵ se seleccionan independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, CH₃, CH₂CH₃, CF₃, F y Cl.
23. El compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 22, en el que R³, R⁴ y R⁵ son, cada uno, hidrógeno.
24. El compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a -23, en el que R⁶ es hidrógeno.
25. El compuesto según la reivindicación 1, seleccionado de la Tabla 1, o una sal del mismo.
26. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 25, o un estereoisómero, tautómero, solvato, profármaco o sal del mismo y un portador, diluyente o excipiente farmacéuticamente aceptable.