

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 00020808 00000005 Folios: 18
Fecha (AMD): 2004-04-27 11:18:58
Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 323 COMPLET
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES
2000-10

①

SOLICITUD DE:



Corrección de Error Material.



Modificación a una Solicitud.

②

SOLICITANTE

Nombre: PFIZER PRODUCTS INC.

Dirección: Eastern Point Road, Estado
de Connecticut, Estados Unidos de
América.
Teléfono: Fax:

E-mail:

Domicilio: ESTADOS UNIDOS DE AMERICA

IDENTIFICACIÓN

C.C.



NIT



C.E.



Otro



Número

③

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: CARLOS R. OLARTE

Dirección: World Trade Center Torre A,
Calle 100 No. 8A-37 Piso 10

Teléfono: 601-7700 Fax: 601-7799

E-mail: office olarteraisbeck.com

IDENTIFICACIÓN

C.C.



NIT



C.E.



Otro



Número 79782747 B.T.P. 74.295

④

Número de expediente:

00.020.808

⑤

Descripción de la corrección o modificación solicitada

VER PAGINA ADJUNTA

⑥

Comprobante de pago No.

24,810

Fecha

24/03/04

⑦

Anexos:



Comprobante de pago de la tasa.



Poderes, si fuere el caso. ver expediente No. 98.037.136



Certificado de existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.



Capítulo Reivindicatorio Modificado

⑧

NOMBRE CARLOS R. OLARTE

FIRMA

C.C. 79782747 T.P. 74.295

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

1587

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 00000003
Fecha (AMD): 2004-04-27 11:18:18
tramite : 002 PATENTES O 1 REGISTRO/ 345 COMERCIAL
Dependencia: 2020 DIVISION DE MARCAS Y DISEÑOS

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 04 - 24,180
FECHA : MARZO 24 DE 2004

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
FREDERICK TORRES	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	9778625	23/03/2004	3,118,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO	
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	12 MARCAS Y LEMAS COMERCIALES	87,000.00
TOTAL :				\$ 87,000.00

SON: OCHENTA Y SIETE MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

3
1588

Modificaciones

La nueva **Reivindicación 1** es idéntica a la Reivindicación 22 original, excepto que se ha escrito de forma independiente.

Las nuevas **Reivindicaciones 2 a 5** son idénticas a las Reivindicaciones 23 a 26 originales, respectivamente.

La nueva **Reivindicación 6** limita Ar^1 a triazinilo.

Las nuevas **Reivindicaciones 7 y 8** son idénticas a las Reivindicaciones 27 y 28 originales, respectivamente.

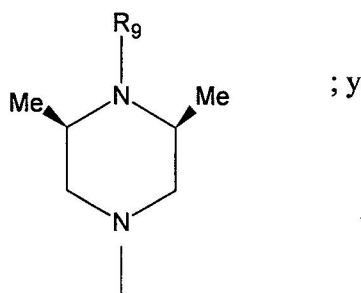
La nueva **Reivindicación 9** es idéntica a la Reivindicación 29, excepto que se ha escrito de forma independiente.

Las nuevas **Reivindicaciones 10 a 13** son idénticas a las Reivindicaciones 30 a 33 originales, respectivamente.

La nueva **Reivindicación 14** limita Ar^1 a triazinilo.

Las nuevas **Reivindicaciones 15 y 16** son idénticas a las Reivindicaciones 35 y 36 originales, respectivamente.

La nueva **Reivindicación 17** se dirige al compuesto específico donde R^1 es (R)-1-hidroxi-etil; R^2 es hidrógeno; R^3 es un radical de fórmula



R^9 es 4,6-dimetil-[1,3,5]-triazin-2-ilo.

La nueva **Reivindicación 18** es idéntica a la Reivindicación 61 original.

La nueva **Reivindicación 19** se dirige al compuesto específico: 1R-{4-[4-(4,6-dimetil-[1,3,5]triazin-2-il)-2R,6S-dimetil-piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol.

La nueva **Reivindicación 20** es una Reivindicación de una composición farmacéutica idéntica a la Reivindicación 47 original, con la excepción que ahora la reivindicación es dependiente múltiple de todas las reivindicaciones de compuestos, es decir de las Reivindicaciones 1 a 19.

Las nuevas **Reivindicaciones 21 a 23** son idénticas a las Reivindicaciones 48 a 50 originales, respectivamente, con la excepción que ahora la reivindicación es dependiente múltiple de todas las reivindicaciones de compuestos, es decir de las Reivindicaciones 1 a 19.

Las nuevas **Reivindicaciones 24 y 25** son nuevas reivindicaciones de método.

Las nuevas **Reivindicaciones 26 a 32** son idénticas a las Reivindicaciones 65 a 71 originales, respectivamente.

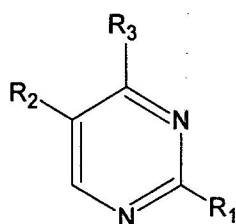
5H
1589

1590

CAPITULO REIVINDICATORIO MODIFICADO

1. Un compuesto de fórmula I

5



10

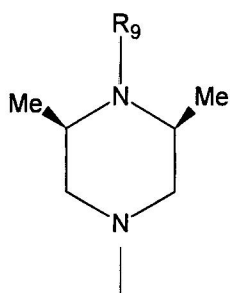
un profármaco del mismo o una sal farmacéuticamente
aceptable de dicho compuesto o de dicho profármaco, en la
15 que:

R^1 es (R)-1-hidroxi-etilo;

R^2 es hidrógeno;

R^3 es un radical de fórmula

20



; y

25

R^9 es pirimidilo o triazinilo; estando dichos pirimidilo o
30 triazinilo opcionalmente sustituidos con hasta dos grupos
hidroxi, alquilo (C_1-C_4), cicloalquilo (C_3-C_7), alcoxi (C_1-C_4),
hidroxi-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alquilenilo

K6
1591

(C₁-C₄), fenilo, piperazinilo opcionalmente sustituido con alquilo (C₁-C₄) o imidazolilo opcionalmente sustituido con hasta dos grupos alquilo (C₁-C₄).

5 2. Un compuesto de la reivindicación 1, un profármaco del mismo o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto o de dicho profármaco, en el que: R⁹ es pirimid-2-ilo opcionalmente sustituido con hasta dos grupos alquilo (C₁-C₄), hidroxialquilo (C₁-C₄) o alcoxi (C₁-C₄)-
10 alquilo (C₁-C₄).

3. El compuesto de la reivindicación 2, un profármaco del mismo o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto o de dicho profármaco, en el que: R⁹ es 4,6-
15 dimetilpirimid-2-ilo; 4-metoximetil-6-metilpirimid-2-ilo; o 4-hidroximetil-6-metilpirimid-2-ilo.

4. Un compuesto de la reivindicación 1, un profármaco del mismo o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho
20 compuesto o de dicho profármaco, donde: R⁹ es pirimid-4-ilo opcionalmente sustituido con hasta dos grupos alquil (C₁-C₄)-piperazin-1-ilo o imidazolilo; y dicho imidazolilo está opcionalmente sustituido con hasta dos grupos alquilo (C₁-C₄).

25

5. El compuesto de la reivindicación 4, un profármaco del mismo o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto o de dicho profármaco, en el que: R⁹ es 2-(4-metilpiperazin-1-il)-pirimid-4-ilo; 2-(4-etilpiperazin-1-
30 il)-pirimid-4-ilo; 2-(4-metilimidazol-1-il)-pirimid-4-ilo; 2-(2-metilimidazol-1-il)-pirimid-4-ilo; 2-(2,4-dimetilimidazol-1-il)-pirimid-4-ilo; o 2-(4-

8-7
1592

isopropilpiperazin-1-il)-pirimid-4-ilo.

6. Un compuesto de la reivindicación 1, un profármaco del mismo o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto o de dicho profármaco, en el que:

R⁹ es triazinilo opcionalmente sustituido con hasta dos grupos hidroxil, alquilo (C₁-C₄), cicloalquilo (C₃-C₇), alcoxi (C₁-C₄), hidroxil-alquilo (C₁-C₄), alcoxi(C₁-C₄)-alquilenilo(C₁-C₄), fenilo, piperazinilo opcionalmente sustituido con alquilo(C₁-C₄), o imidazolilo opcionalmente sustituido con hasta dos grupos alquilo (C₁-C₄).

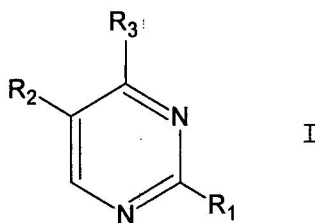
7. Un compuesto de la reivindicación 6, un profármaco del mismo o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto o de dicho profármaco, en el que: R⁹ es [1,3,5]-triazin-2-ilo opcionalmente sustituido con hasta dos grupos alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), hidroxil-alquilo (C₁-C₄), alquil (C₁-C₄)-piperazin-1-ilo o fenilo.

8. El compuesto de la reivindicación 7, un profármaco del mismo o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto o de dicho profármaco, en el que: R⁹ es 4-metil-6-(4-metilpiperazin-1-il)-[1,3,5]-triazin-2-ilo; 4-metoxi-6-metil-[1,3,5]-triazin-2-ilo; 4,6-dimetoxi-[1,3,5]-triazin-2-ilo; 4-etoxi-6-metil-[1,3,5]-triazin-2-ilo; 4-isopropoxi-6-metil-[1,3,5]-triazin-2-ilo; 4-fenil-[1,3,5]-triazin-2-ilo; 4-hidroximetil-6-metoxi-[1,3,5]-triazin-2-ilo; 4-isopropoxi-6-metoxi-[1,3,5]-triazin-2-ilo; 4-isopropil-[1,3,5]-triazin-2-ilo; 4-etil-6-metoxi-[1,3,5]-triazin-2-ilo; 4-ciclopropil-[1,3,5]-triazin-2-ilo; 4,6-dimetil-[1,3,5]-triazin-2-ilo; o 4-metil-6-fenil-[1,3,5]-triazin-2-ilo.

~~256~~
1593

9. Un compuesto de fórmula I

5



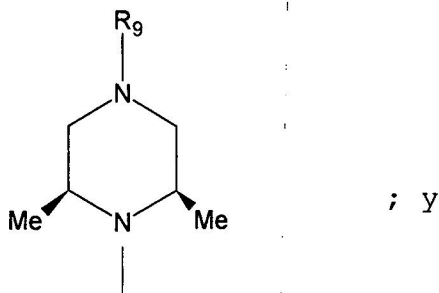
un profármaco del mismo o una sal farmacéuticamente
10 aceptable de dicho compuesto o de dicho profármaco, en el
que:

R^1 es (R)-1-hidroxi-etilo;

R^2 es hidrógeno;

R^3 es un radical de fórmula

15



20

R^9 es pirimidilo o triazinilo, estando dicho pirimidilo o
triazinilo opcionalmente sustituidos con hasta dos grupos
25 hidroxilo, alquilo (C_1-C_4), cicloalquilo (C_3-C_7), alcoxi (C_1-C_4),
hidroxilo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4),
triazolilo, acetilo, morfolinilo, alquil (C_1-C_4)-
piperazinilo, fenilo o imidazolilo opcionalmente
sustituido con hasta dos grupos alquilo (C_1-C_4).

30

10. Un compuesto de la reivindicación 9, un profármaco
del mismo o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho

~~80~~
1599

compuesto o de dicho profármaco, en el que: R⁹ es pirimid-2-ilo opcionalmente sustituido con hasta dos grupos alquilo (C₁-C₄), hidroxialquilo (C₁-C₄) o triazolilo.

5 11. El compuesto de la reivindicación 10, un profármaco del mismo o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto o de dicho profármaco, en el que: R⁹ es 4,6-dimetil-pirimid-2-ilo; 4-hidroximetil-6-metilpirimid-2-ilo; o 4-[1,2,4]-triazol-1-il-pirimid-2-ilo.

10

12. Un compuesto de la reivindicación 9, un profármaco del mismo o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto o de dicho profármaco, en el que: R⁹ es pirimid-4-ilo opcionalmente sustituido con hasta dos grupos
15 alquilo (C₁-C₄), hidroxialquilo (C₁-C₄), acetilo, morfolinilo, alquil (C₁-C₄)-piperazinilo, triazolilo o imidazolilo opcionalmente sustituido con hasta dos grupos alquilo (C₁-C₄).

20 13. El compuesto de la reivindicación 12, un profármaco del mismo o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto o de dicho profármaco, en el que: R⁹ es 2,6-dimetil-pirimid-4-ilo; 2-hidroximetil-6-metil-pirimid-4-ilo; 2-acetil-pirimid-4-ilo; 2-morfolin-4-il-pirimid-4-ilo; 2-(4-metilpiperazin-1-il)-pirimid-4-ilo; 2-[1,2,4]-
25 triazol-1-il-pirimid-4-ilo; 2-(1S-hidroxietil)-pirimid-4-ilo; 2-(1R-hidroxietil)-pirimid-4-ilo; 2-(4-etilpiperazin-1-il)-pirimid-4-ilo; 2-(4-metilimidazol-1-il)-pirimid-4-ilo; o 2-(2,4-dimetilimidazol-1-il)-pirimid-4-ilo.

30

14. El compuesto de la reivindicación 9, un profármaco del mismo o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho

~~10~~
1595

compuesto o de dicho profármaco, en el que: R⁹ es triazinilo opcionalmente sustituido con hasta dos grupos hidroxilo, alquilo (C₁-C₄), cicloalquilo (C₃-C₇), alcoxi (C₁-C₄), hidroxilo-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄),
5 triazolilo, acetilo, morfolinilo, alquil (C₁-C₄) piperazinilo, fenilo o imidazolilo opcionalmente sustituido con hasta dos grupos alquilo (C₁-C₄).

15. Un compuesto de la reivindicación 14, un profármaco
10 del mismo o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto o de dicho profármaco, en el que: R⁹ es [1,3,5]-triazin-2-ilo opcionalmente sustituido con hasta dos grupos hidroxilo, alquilo (C₁-C₄), cicloalquilo (C₃-C₇), hidroxilo-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄),
15 alcoxi (C₁-C₄), morfolinilo o fenilo.

16. El compuesto de la reivindicación 15, un profármaco del mismo o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto o de dicho profármaco, en el que: R⁹ es 4-
20 morfolin-4-il-[1,3,5]-triazin-2-ilo; 4-metoxi-6-metil-[1,3,5]-triazin-2-ilo; 4,6-dimetoxi-[1,3,5]-triazin-2-ilo; 4-fenil-[1,3,5]-triazin-2-ilo; 4-ciclopropil-[1,3,5]-triazin-2-ilo; 4,6-dimetil-[1,3,5]-triazin-2-ilo; 4-hidroximetilo-6-fenil-[1,3,5]-triazin-2-ilo; 4-metoxi-6-
25 metoximetil-[1,3,5]-triazin-2-ilo; 4-metil-[1,3,5]-triazin-2-ilo; o 4-metoximetil-6-fenil-[1,3,5]-triazin-2-ilo.

17. El compuesto de la reivindicación 16, en el que: R⁹ es
30 4,6-dimetil-[1,3,5]-triazin-2-ilo.

18. Un compuesto seleccionado entre:

1596

- 1R-(4-{1'-[2-(1R-hidroxi-etil)-pirimidin-4-il]-
[4,4']bipiperidinil-1-il}-pirimidin-2-il)-etanol;
furo[3,2-c]piridin-2-il-{4-[2-(1R-hidroxi-etil)-pirimidin-
4-il]-3R,5S-dimetil-piperazin-1-il}-metanona;
5 (4-cloro-furo[3,2-c]piridin-2-il)-{4-[2-(1R-hidroxi-etil)-
pirimidin-4-il]-3R,5S-dimetil-piperazin-1-il}-metanona;
{4-[2-(1R-hidroxi-etil)-pirimidin-4-il]-3R,5S-dimetil-
piperazin-1-il}-(4-pirrolidin-1-il-furo[3,2-c]piridin-2-
il)-metanona;
10 {4-[2-(1R-hidroxi-etil)-pirimidin-4-il]-3R,5S-dimetil-
piperazin-1-il}-(4-morfolin-4-il-furo[3,2-c]piridin-2-il)-
metanona;
{4-[2-(1R-hidroxi-etil)-pirimidin-4-il]-3R,5S-dimetil-
piperazin-1-il}-imidazo[1,2-a]piridin-2-il-metanona;
15 furo[3,2-c]piridin-2-il-{4-[2-(1R-hidroxi-etil)-pirimidin-
4-il]-2R,6S-dimetil-piperazin-1-il}-metanona;
piridin-3-il éster del ácido 4-[2-(1R-hidroxi-etil)-
pirimidin-4-il]-2R,6S-dimetil-piperazina-1-carboxílico;
2-metil-piridin-3-il éster del ácido 4-[2-(1R-hidroxi-
20 etil)-pirimidin-4-il]-2R,6S-dimetil-piperazina-1-
carboxílico;
5-cloro-piridin-3-il éster del ácido 4-[2-(1R-hidroxi-
etil)-pirimidin-4-il]-2R,6S-dimetil-piperazina-1-
carboxílico;
25 6-metil-piridin-3-il éster del ácido 4-[2-(1R-hidroxi-
etil)-pirimidin-4-il]-2R,6S-dimetil-piperazina-1-
carboxílico;
(E)-1-{4-[2-(1R-hidroxi-etil)-pirimidin-4-il]-2R,6S-
dimetil-piperazin-1-il}-3-tiofen-2-il-propenona;
30 1R-{4-[4-(4,6-dimetil-pirimidin-2-il)-3R,5S-dimetil-
piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
1R-{4-[4-(4-metoximetil-6-metil-pirimidin-2-il)-3R,5S-

- dimetil-piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
1R-{4-[4-(4-hidroximetil-6-metil-pirimidin-2-il)-3R,5S-
dimetil-piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
1R-(4-{3R,5S-dimetil-4-[2-(4-metil-piperazin-1-il)-
5 pirimidin-4-il]-piperazin-1-il}-pirimidin-2-il)-etanol;
1R-4-{4-[2-(4-etil-piperazin-1-il)-pirimidin-4-il]-3R,5S-
dimetil-piperazin-1-il}-pirimidin-2-il)-etanol;
1R-(4-{3R,5S-dimetil-4-[2-(4-metil-imidazol-1-il)-
pirimidin-4-il]-piperazin-1-il}-pirimidin-2-il)-etanol;
10 1R-(4-{3R,5S-dimetil-4-[2-(2-metil-imidazol-1-il)-
pirimidin-4-il]-piperazin-1-il}-pirimidin-2-il)-etanol;
1R-(4-{4-[2-(2,4-dimetil-imidazol-1-il)-pirimidin-4-il]-
3R,5S-dimetil-piperazin-1-il}-pirimidin-2-il)-etanol;
1R-(4-{4-[2-(4-isopropil-piperazin-1-il)-pirimidin-4-il]-
15 3R,5S-dimetil-piperazin-1-il}-pirimidin-2-il)-etanol;
1R-(4-{3R,5S-dimetil-4-[4-metil-6-(4-metil-piperazin-1-
il)-[1,3,5]triazin-2-il]-piperazin-1-il}-pirimidin-2-il)-
etanol; 1R-{4-[4-(4-metoksi-6-metil-[1,3,5]triazin-2-il)-
3R,5S-dimetil-piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
20 1R-{4-[4-(4,6-dimetoksi-[1,3,5]triazin-2-il)-3R,5S-dimetil-
piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
1R-{4-[4-(4-etoksi-6-metil-[1,3,5]triazin-2-il)-3R,5S-
dimetil-piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
1R-{4-[4-(4-isopropoksi-6-metil-[1,3,5]triazin-2-il)-3R,5S-
25 dimetil-piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
1R-{4-[3R,5S-dimetil-4-(4-fenil-[1,3,5]triazin-2-il)-
piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
1R-{4-[4-(4-hidroximetil-6-metoksi-[1,3,5]triazin-2-il)-
3R,5S-dimetil-piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
30 1R-{4-[4-(4-isopropoksi-6-metoksi-[1,3,5]triazin-2-il)-
3R,5S-dimetil-piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
1R-{4-[4-(4-isopropil-[1,3,5]triazin-2-il)-3R,5S-dimetil-

1597

1598

- piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
1R-{4-[4-(4-etil-6-metoksi-[1,3,5]triazin-2-il)-3R,5S-
dimetil-piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
1R-{4-[4-(4,6-dimetil-pirimidin-2-il)-2R,6S-dimetil-
5 piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
1R-{4-[4-(4-hidroximetil-6-metil-pirimidin-2-il)-2R,6S-
dimetil-piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
1R-{4-[2R,6S-dimetil-4-(4-[1,2,4]triazol-1-il-pirimidin-2-
il)-piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
10 1R-{4-[4-(2,6-dimetil-pirimidin-4-il)-2R,6S-dimetil-
piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
1R-(4-{4-[2-(1R-hidroxi-etil)-pirimidin-4-il]-2R,6S-
dimetil-piperazin-1-il}-pirimidin-2-il)-etanol;
1R-{4-[4-(2-hidroximetil-6-metil-pirimidin-4-il)-2R,6S-
15 dimetil-piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
1R-(4-{4-[2-(1S-hidroxi-etil)-pirimidin-4-il]-2R,6S-
dimetil-piperazin-1-il}-pirimidin-2-il)-etanol;
1S-(4-{4-[2-(1R-hidroxi-etil)-pirimidin-4-il]-2R,6S-
dimetil-piperazin-1-il}-pirimidin-2-il)-etanol;
20 1-{4-[4-(2-acetil-pirimidin-4-il)-2R,6S-dimetil-piperazin-
1-il]-pirimidin-2-il}-etanona;
1RS-(4-{4-[2-(1RS-hidroxi-etil)-pirimidin-4-il]-2R,6S-
dimetil-piperazin-1-il}-pirimidin-2-il)-etanol;
(4-{4-[2-(1R-hidroxi-etil)-pirimidin-4-il]-3R,5S-dimetil-
25 piperazin-1-il}-pirimidin-2-il)-etanona;
1R-{4-[2R,6S-dimetil-4-(2-morfolin-4-il-pirimidin-4-il)-
piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
1R-(4-{2R,6S-dimetil-4-[2-(4-metil-piperazin-1-il)-
pirimidin-4-il]-piperazin-1-il}-pirimidin-2-il)-etanol;
30 1R-{4-[2R,6S-dimetil-4-(2-[1,2,4]triazol-1-il-pirimidin-4-
il)-piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
1R-(4-{4-[2-(1R-hidroxi-etil)-pirimidin-4-il]-2R,6R-

1599

- dimetil-piperazin-1-il}-pirimidin-2-il)-etanol;
1R-(4-{4-[2-(4-etil-piperazin-1-il)-pirimidin-4-il]-2R,6S-
dimetil-piperazin-1-il}-pirimidin-2-il)-etanol;
1R-(4-{2R,6S-dimetil-4-[2-(4-metil-imidazol-1-il)-
5 pirimidin-4-il]-piperazin-1-il}-pirimidin-2-il)-etanol;
1R-(4-{4-[2-(2,4-dimetil-imidazol-1-il)-pirimidin-4-il]-
2R,6S-dimetil-piperazin-1-il}-pirimidin-2-il)-etanol;
1R-{4-[2R,6S-dimetil-4-(4-morfolin-4-il-[1,3,5]triazin-2-
il)-piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
10 1R-{4-[4-(4-metoxi-6-metil-[1,3,5]triazin-2-il)-2R,6S-
dimetil-piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
1R-{4-[4-(4,6-dimetoxi-[1,3,5]triazin-2-il)-2R,6S-dimetil-
piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
1R-{4-[2R,6S-dimetil-4-(4-fenil-[1,3,5]triazin-2-il)-
15 piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
1R-{4-[4-(4-hidroximetil-6-metil-pirimidin-2-il)-3S-metil-
piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
1R-{4-[4-(2-hidroximetil-pirimidin-4-il)-3S-metil-
piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
20 1R-{4-[4-(2-hidroximetil-6-metil-pirimidin-4-il)-3S-metil-
piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
1R-[4-(3S-metil-4-oxazolo[5,4-b]piridin-2-il-piperazin-1-
il)-pirimidin-2-il]-etanol;
1R-[4-(3S-metil-4-oxazolo[4,5-b]piridin-2-il-piperazin-1-
25 il)-pirimidin-2-il]-etanol;
1R-[4-(3S-metil-4-quinoxalin-2-il-piperazin-1-il)-
pirimidin-2-il]-etanol;
1R-{4-[4-(4,6-dimetil-[1,3,5]triazin-2-il)-3R,5S-dimetil-
piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
30 1R-{4-[3R,5S-dimetil-4-(4-metil-6-fenil-[1,3,5]triazin-2-
il)-piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
1R-{4-[4-(4-ciclopropil-[1,3,5]triazin-2-il)-3R,5S-

1600

- dimetil-piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
 1R-{4-[4-(4-ciclopropil-[1,3,5]triazin-2-il)-2R,6S-
 dimetil-piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
 1R-{4-[4-(4,6-dimetil-[1,3,5]triazin-2-il)-2R,6S-dimetil-
 5 piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
 1R-{4-[4-(4-hidroximetil-6-fenil-[1,3,5]triazin-2-il)-
 2R,6S-dimetil-piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
 1R-{4-[4-(4-metoxi-6-metoximetil-[1,3,5]triazin-2-il)-
 2R,6S-dimetil-piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
 10 1R-{4-[2R,6S-dimetil-4-(4-metil-[1,3,5]triazin-2-il)-
 piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
 1-{4-[4-(2-acetil-pirimidin-4-il)-2R*,6S*-dimetil-
 piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanona;
 1-(4-{4-[2-(1R-hidroxi-etil)-pirimidin-4-il]-2R,6S-
 15 dimetil-piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanona;
 1R-{4-[4-(4-metoximetil-6-fenil-[1,3,5]triazin-2-il)-
 2R,6S-dimetil-piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol;
 (4-{4-[2-(1R-hidroxi-etil)-pirimidin-4-il]-2R,5S-dimetil-
 piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol; y
 20 1S-(4-{4-[2-(1R-hidroxi-etil)-pirimidin-4-il]-2R,6S-
 dimetil-piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol.
19. 1R-{4-[4-(4,6-dimetil-[1,3,5]triazin-2-il)-2R,6S-
 dimetil-piperazin-1-il]-pirimidin-2-il}-etanol.

25

20. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 19, un profármaco del mismo o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto o de dicho profármaco y un vehículo o
 30 un diluyente farmacéuticamente aceptable.

21. El uso de un compuesto de cualquiera de las

17/26
1601

revindicaciones 1 a 19 en la preparación de un medicamento para la inhibición de la sorbitol deshidrogenasa.

22. El uso de un compuesto de cualquiera de las 5 revindicaciones 1 a 19 en la preparación de un medicamento para el tratamiento de la diabetes.

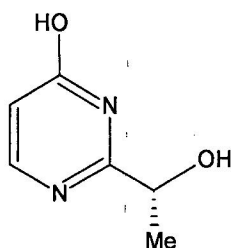
23. El uso de un compuesto de cualquiera de las revindicaciones 1 a 19 en la preparación de un medicamento 10 para el tratamiento de las complicaciones diabéticas.

24. El uso de la reivindicación 23 donde dicha complicación diabética es nefropatía diabética.

15 25. El uso de la reivindicación 23 donde dicha complicación diabética es neuropatía diabética.

26. Un compuesto de fórmula Z

20

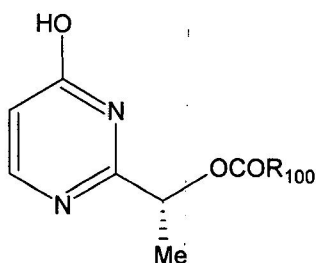


Z

25

27. Un compuesto de fórmula ZZ

30



ZZ

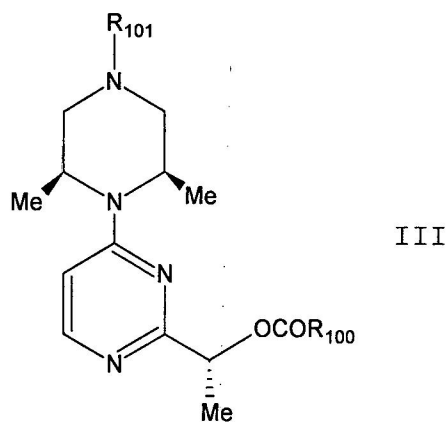
160247

en la que R^{100} es alquilo (C_1-C_8), bencilo o fenilo, estando dichos bencilo y fenilo opcionalmente sustituidos con 5 hasta tres grupos halo o alquilo (C_1-C_4).

28. Un compuesto de fórmula III,

10

15



20

en la que:

R^{100} es alquilo (C_1-C_8), bencilo o fenilo, estando dichos bencilo y fenilo opcionalmente sustituidos con hasta tres grupos halo o alquilo (C_1-C_4); y

25 R^{101} es hidrógeno o un grupo protector de amina adecuado.

29. Un compuesto de la reivindicación 28, en el que R^{100} es alquilo (C_1-C_4) y R^{101} es bencilo o t-butiloxycarbonilo.

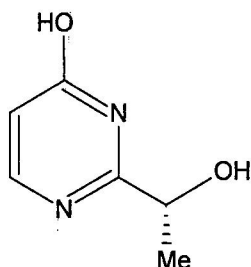
30 30. Un compuesto de la reivindicación 29, en el que R^{100} es n-butilo o etilo y R^{101} es bencilo.

1603

31. Un compuesto de la reivindicación 29, en el que R^{100} es n-butilo o etilo y R^{101} es t-butiloxicarbonilo.

32. Un procedimiento para preparar un compuesto de fórmula Z,

10



15 que comprende:

a) hacer reaccionar R-(+)-2-hidroxi-propionamida con tetrafluoroborato de trietiloxonio en un disolvente inerte a la reacción, durante un período de 10 minutos a 24 horas, a una temperatura de 0°C a la temperatura ambiente, para formar el imidato correspondiente;

b) hacer reaccionar dicho imidato correspondiente con amoniaco anhidro en un disolvente inerte a la reacción, durante un período de 2 horas a 24 horas, a una temperatura de 0°C a la temperatura ambiente, para formar clorhidrato de R-(+)-2-hidroxi-propionamidina; y

c) hacer reaccionar dicho clorhidrato de R-(+)-2-hidroxi-propionamidina con la sal sódica de 3-hidroxi-acrilato de etilo y una base adecuada en un disolvente inerte a la reacción, para formar dicho compuesto de fórmula Z.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

1609

RADICACIÓN: 0-20808

EDICTO No. 10073

LA SECRETARÍA GENERAL AD-HOC
HACE SABER:

Que esta Superintendencia profirió Resolución No. 17997 de 27-JUL-2005. Que el contenido de la parte resolutive es como sigue: El Superintendente de Industria y Comercio.

RESUELVE

ARTICULO PRIMERO: Negar el privilegio de patente de invención para la solicitud correspondiente a "DERIVADOS DE PIRIMIDINA Y COMPUESTOS RELACIONADOS INHIBIDORES DE LA SORBITOL DESHIDROGENASA".

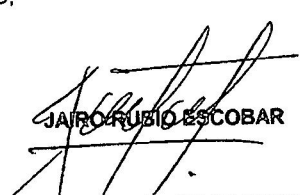
ARTICULO SEGUNDO: Notificar personalmente el contenido de la presente resolución al doctor Carlos R. Olarte, o a quien haga sus veces, en su calidad de apoderado de Pfizer Products Inc., entregándole copia de la misma, advirtiéndole que contra ella procede el recurso de reposición interpuesto ante el Superintendente de Industria y Comercio, al momento de la notificación o dentro de los 5 días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CUMPLASE

Dada en Bogotá, D.C., a los

27 JUL 2005

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,


JAIRORUBIO ESCOBAR

Para notificar a los interesados, se fija el presente EDICTO en lugar visible al público en la SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO, por el término de (10) diez días hábiles contados a partir de las 8:30 a.m. de hoy.

Secretaría General Ad-Hoc 19-AGO-2005

Este edicto se desfija hoy 01-SEP-2005 a las cinco (5:00 p.m.)

Secretaría General Ad-Hoc

EDICTO No. 10073