



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-123805- -00002-0000

Fecha: 2010-03-25 18:03:26 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 12

FORMULARIO UNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES
2000-10

1

SOLICITUD DE:

☐ Corrección de Error Material

☒ Modificación a una solicitud

2

SOLICITANTE

Nombre: **SANOFI-AVENTIS**
sociedad constituida y existente de acuerdo con las leyes de Francia.

Dirección: 174 avenue de France,
75013 Paris,
Francia

Teléfono: 546 09 70
E-mail: clientes@cavelier.com
Fax: 249 40 70

Domicilio: Paris,
Francia

IDENTIFICACION

C.C. ☐

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Número: _____

3

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: Luz Clemencia de Páez

Dirección: Carrera 4ª No. 72-35

Teléfono: 347 36 11

E-mail: cavelier@cavelier.com

Fax: 217 92 11

Domicilio: Bogotá, Colombia

IDENTIFICACION

C.C. ☒

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Número: 35.456.344 TP 23.555

4

Número de expediente: 09.123.805

Clase: C07D 333/068

Título: **ACIDOS BENZOILAMINO-INDAN-2-CARBOXÍLICOS SUSTITUIDOS Y COMPUESTOS RELACIONADOS**

5

Descripción de la corrección o modificación solicitada

Informo a ese Despacho que presento un nuevo pliego reivindicatorio, conformado por 20 reivindicaciones, sobre el cual solicito se efectúe el correspondiente examen de patentabilidad. (Ver hojas anexas).

6

Comprobante de pago No. 10-17,885

Fecha: 08 de marzo de 2010

7

Anexos:

☒ Comprobante de pago de la tasa por concepto de modificación de solicitud en trámite.

☐ Poderes, si fuere el caso

☐ Certificado de existencia y representación legal, cuando el solicitante sea persona jurídica

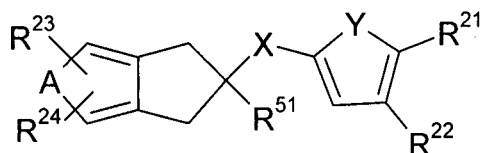
8

NOMBRE: LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ

FIRMA: Luz Clemencia de Páez
C.C. 35.456.344 de Usaquén T.P. 23.555

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la fórmula Ia



en la que:

A es CH=CH o S;

R^{23} es hidrógeno, halógeno, alquilo (C_1-C_4), alquiloxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-S- o nitro;

R^{24} es hidrógeno o halógeno cuando A es CH=CH, o es hidrógeno, halógeno, alquilo (C_1-C_4), alquiloxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-S-, o nitro cuando A es S;

X es N(H)C=O, N(H)S(O)₂, C=ON(H) o S(O)₂N(H);

Y es N(R^{11}), S, O, C(R^{12})=C(R^{13}), N=C(R^{14}) o C(R^{15})=N, o carbociclilo fusionado de 5-7 miembros opcionalmente sustituido;

R^{11} es hidrógeno, alquilo (C_1-C_{10}), hidroxialquil (C_1-C_{10})-, alquiloxi (C_1-C_{10}), alquil (C_1-C_{10})-S(O)_m-, alquilcarbonil (C_1-C_{10})-, fenilo, amino, alquilamino (C_1-C_{10}) o di(alquil (C_1-C_{10}))amino;

R^{12} es hidrógeno, halógeno, alquilo (C_1-C_{10}), alquenilo (C_2-C_{10}), cicloalquiloxi (C_3-C_6), cicloalquenilo (C_3-C_{10}), cicloalquilo (C_3-C_6), cicloalquenilo (C_3-C_{10}), cicloalquil (C_3-C_6)-alquilo[(C_1-C_4) o alquenilo (C_2-C_4)], cicloalquil (C_3-C_6)-alquiloxi(C_1-C_4), hidroxialquilo(C_1-C_{10}), alquiloxi (C_1-C_{10}), alquenilo (C_2-C_{10}), alquil (C_1-C_{10})-S-, ciano, alquilcarbonilo (C_1-C_{10}), fenilo o nitro;

R^{13} es hidrógeno, halógeno o alquilo (C_1);

R^{14} es hidrógeno, halógeno, alquilo (C_1-C_4), hidroxialquil (C_1-C_3)-, alquiloxi (C_1-C_3), alquil (C_1-C_3)-S(O)_m-, ciano, alquilcarbonil (C_1-C_2)-, amino, alquilamino (C_1-C_3), di(alquil (C_1-C_3))amino o nitro, con la condición de que el número total de átomos de C, N, O y S que están presentes en R^{14} no supere 4;

R^{15} es hidrógeno, halógeno, alquilo (C_1-C_{10}), alqueno (C_2-C_{10}), cicloalquilo (C_3-C_6), cicloalqueno (C_3-C_6), cicloalquil (C_3-C_6)-[alquilo (C_1-C_4) o alqueno (C_2-C_4)], hidroxialquil (C_1-C_{10})-, ciano, alquilcarbonil (C_1-C_{10})-, fenilo, amino, [alquil (C_1-C_{10}) o alqueno (C_2-C_{10})]amino, [alquil (C_1-C_{10}) o alqueno (C_2-C_{10})](alquil (C_1-C_{10}))amino o nitro;

R^{21} es hidrógeno cuando Y es $C(R^{12})=C(R^{13})$, $N=C(R^{14})$ o $C(R^{15})=N$, y es hidrógeno, halógeno, alquilo (C_1-C_4), hidroxialquil (C_1-C_3)-, alquiloxi (C_1-C_3), alquil (C_1-C_3)-S(O)_m-, ciano, alquilcarbonil (C_1-C_2)-, amino, alquilamino (C_1-C_3), di(alquil (C_1-C_3))amino o nitro cuando Y es $N(R^{11})$, S u O, con la condición de que el número total de átomos de C, N, O y S que están presentes en R^{21} no supere 4;

R^{22} es hidrógeno, halógeno, alquilo (C_1) cuando Y es $C(R^{12})=C(R^{13})$, $N=C(R^{14})$ o $C(R^{15})=N$, o es hidrógeno, hidroxialquil (C_1-C_3)-, alquiloxi (C_1-C_3), alquil (C_1-C_3)-S(O)_m-, ciano, alquilcarbonil (C_1-C_2)-, amino, alquilamino (C_1-C_3), di(alquil (C_1-C_3))amino o nitro cuando Y es $N(R^{11})$, S u O, con la condición de que el número total de átomos de C, N, O y S que están presentes en R^{22} no supere 4;

R^{51} es COOH o CONH(R^{53});

R^{53} es R^{55} -SO₂- o tetrazolilo;

R^{55} es alquilo (C_1-C_4) o fenilo opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes iguales o diferentes elegidos entre

el grupo que consiste en halógeno, alquilo (C_1-C_4), alquiloxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-sulfonilo y ciano; y m es 0, 1 ó 2;

donde todos los grupos fenilo de esta memoria pueden estar independientemente entre sí opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes iguales o diferentes elegidos entre el grupo que consiste en halógeno, alquilo (C_1-4), alquiloxi (C_1-4), alquilsulfonilo (C_1-4) y ciano;

donde todos los grupos alquilo de esta memoria pueden estar independientemente entre sí opcionalmente sustituidos con uno o más átomos de flúor; o

una forma estereoisomérica del mismo, una mezcla de formas estereoisoméricas del mismo en cualquier proporción o una sal fisiológicamente aceptable del mismo.

2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en el que

R^{23} es hidrógeno, halógeno, alquilo (C_1-C_4) o alquiloxi (C_1-C_4);

R^{24} es hidrógeno o halógeno cuando A es $CH=CH$, o es hidrógeno, halógeno o alquilo (C_1-C_4) cuando A es S;

X es $N(H)C=O$, $N(H)S(O)_2$ o $C=ON(H)$;

Y es $C(R^{12})=C(R^{13})$ o $C(R^{15})=N$, o carbociclilo de 5-6 miembros, opcionalmente sustituido y fusionado;

R^{12} es alquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_3-C_6), cicloalquiloxi (C_4-C_6), cicloalquilo (C_5-C_6), cicloalquenilo (C_5-C_6), cicloalquil (C_3)-[alquilo (C_2) o alquenilo (C_2)], cicloalquil (C_3)-alquiloxi (C_1), alquiloxi (C_3-C_4), alqueniloxi (C_3), alquil (C_1-C_3)-S-, alquilcarbonilo (C_3), fenilo;

R^{13} es hidrógeno, halógeno o alquilo (C_1);

R^{15} es alquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_2-C_6) o [alquil (C_2-C_3) o alquenil (C_3)](alquil (C_1))amino;

R^{21} es hidrógeno cuando Y es $C(R^{12})=C(R^{13})$ o $C(R^{15})=N$;

R^{22} es hidrógeno o halógeno, alquilo (C_1) cuando Y es $C(R^{12})=C(R^{13})$ o $C(R^{15})=N$;

R^{51} es $COOH$;

donde todos los grupos fenilo de esta memoria pueden estar independientemente entre sí opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes iguales o diferentes elegidos entre el grupo que consiste en halógeno, alquilo (C_{1-4}), alquiloxi (C_{1-4}), alquilsulfonilo (C_{1-4}) y ciano;

donde todos los grupos alquilo de esta memoria pueden estar independientemente entre sí opcionalmente sustituidos con uno o más átomos de flúor; o

una forma estereoisomérica del mismo, una mezcla de formas estereoisoméricas del mismo en cualquier proporción o una sal fisiológicamente aceptable del mismo.

3. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en el que

A es $CH=CH$.
4. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en el que

X es $N(H)C=O$.
5. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en el que

Y es $C(R^{12})=C(R^{13})$.
6. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en el que

Y es $C(R^{15})=N$.

7. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en el que

Y es carbociclilo de 5-6 miembros, opcionalmente sustituido y fusionado.
8. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en el que

 R^{21} es hidrógeno.
9. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en el que

 R^{22} es hidrógeno o halógeno o alquilo (C_1) cuando Y es $C(R^{12})=C(R^{13})$.
10. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en el que

 R^{51} es COOH.
11. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 seleccionado entre:
ácido 2-(2-aliloxi-3-metil-benzoilamino)-indan-2-carboxílico,
ácido 2-(2-isopropoxi-3-metil-benzoilamino)-indan-2-carboxílico,
ácido 2-(2-ciclobutoxi-3-metil-benzoilamino)-indan-2-carboxílico,
ácido 2-(2-ciclopropilmetoxi-3-metil-benzoilamino)-indan-2-carboxílico,
ácido 2-(2-sec-butoxi-3-metil-benzoilamino)-indan-2-carboxílico,
ácido 2-(3-cloro-2-isopropoxi-benzoilamino)-indan-2-carboxílico
ácido 2-(2-aliloxi-3-cloro-benzoilamino)-indan-2-carboxílico,
ácido 2-(3,5-dicloro-2-ciclobutoxi-benzoilamino)-5-fluoro-indan-2-carboxílico,

ácido 2-(3,5-dicloro-2-isopropoxi-bencenosulfonilamino)-
indan-2-carboxílico,
ácido 2-(2-aliloxi-3,5-dicloro-bencenosulfonilamino)-indan-
2-carboxílico,
ácido 2-[(5,6,7,8-tetrahidro-naftaleno-1-carbonil)-amino]-
indan-2-carboxílico,
ácido 1,3-dimetil-5-[(5,6,7,8-tetrahidro-naftaleno-1-
carbonil)-amino]-5,6-dihidro-4H-ciclopenta[c]tiofeno-5-
carboxílico,
ácido 5-metoxi-2-[(5,6,7,8-tetrahidro-naftaleno-1-carbonil)-
amino]-indan-2-carboxílico,
ácido 2-[(5,6,7,8-tetrahidro-naftaleno-1-carbonil)-amino]-5-
trifluorometil-indan-2-carboxílico
ácido 5-fluoro-2-[(5,6,7,8-tetrahidro-naftaleno-1-carbonil)-
amino]-indan-2-carboxílico,
ácido 5-(2-isopropoxi-3-metil-benzoilamino)-1,3-dimetil-5,6-
dihidro-4H-ciclopenta[c]tiofeno-5-carboxílico,
ácido 2-(2-isopropoxi-3-metil-benzoilamino)-5-metoxi-indan-
2-carboxílico,
ácido 2-(2-isopropoxi-3-metil-benzoilamino)-5-
trifluorometil-indan-2-carboxílico,
ácido 5-fluoro-2-(2-isopropoxi-3-metil-benzoilamino)-indan-
2-carboxílico,
ácido 2-(2-ciclobutoxi-3-metil-benzoilamino)-5-trifluoro-
indan-2-carboxílico,
ácido 5-bromo-2-(2-ciclobutoxi-3-metil-benzoilamino)-indan-
2-carboxílico,
ácido 2-(2-ciclobutoxi-3-metil-benzoilamino)-5-fluoro-indan-
2-carboxílico,
ácido 2-(2-ciclobutoxi-3-metil-benzoilamino)-5,6-difluoro-
indan-2-carboxílico,
ácido 2-[3-metil-2-((Z)-pent-1-enil)-benzoilamino]-indan-2-
carboxílico,
ácido 2-(3-metil-2-pentil-benzoilamino)-indan-2-carboxílico,
ácido 2-[2-(1-etil-but-1-enil)-3-metil-benzoilamino]-indan-
2-carboxílico,
ácido 2-[2-(1-etil-butil)-3-metil-benzoilamino]-indan-2-
carboxílico,

ácido 2-(2-ciclopent-1-enil-3-metil-benzoilamino)-indan-2-carboxílico,
ácido 2-(2-ciclopentil-3-metil-benzoilamino)-indan-2-carboxílico,
ácido 2-[3-metil-2-(2-metil-propenil)-benzoilamino]-indan-2-carboxílico,
ácido 2-(2-isobutil-3-metil-benzoilamino)-indan-2-carboxílico,
ácido 2-[2-(-2-ciclopropil-vinil)-3-metil-benzoilamino]-indan-2-carboxílico,
ácido 2-[2-(2-ciclopropil-etil)-3-metil-benzoilamino]-indan-2-carboxílico,
ácido 2-(2-ciclohex-1-enil-3-metil-benzoilamino)-indan-2-carboxílico,
ácido 2-[3-metil-2-(1-propenil)-benzoilamino]-indan-2-carboxílico,
ácido 2-(3-metil-2-propil-benzoilamino)-indan-2-carboxílico,
ácido 2-[3-metil-2-((E)-pent-1-enil)-benzoilamino]-indan-2-carboxílico,
ácido 5-fluoro-2-[3-metil-2-(2-metil-propenil)-benzoilamino]-indan-2-carboxílico,
ácido 5-fluoro-2-(2-isobutil-3-metil-benzoilamino)-indan-2-carboxílico,
ácido 2-(2-ciclopent-1-enil-3-metil-benzoilamino)-5-fluoro-indan-2-carboxílico,
ácido 5-fluoro-2-[3-metil-2-((E)-propenil)-benzoilamino]-indan-2-carboxílico,
ácido 5-fluoro-2-(2-isobutil-3-metil-benzoilamino)-indan-2-carboxílico,
ácido 5,6-difluoro-2-[3-metil-2-(2-metil-propenil)-benzoilamino]-indan-2-carboxílico,
ácido 5,6-difluoro-2-(2-isobutil-3-metil-benzoilamino)-indan-2-carboxílico,
ácido 5,6-difluoro-2-(3-metil-2-propenil-benzoilamino)-indan-2-carboxílico,
ácido 5,6-difluoro-2-(3-metil-2-propil-benzoilamino)-indan-2-carboxílico,

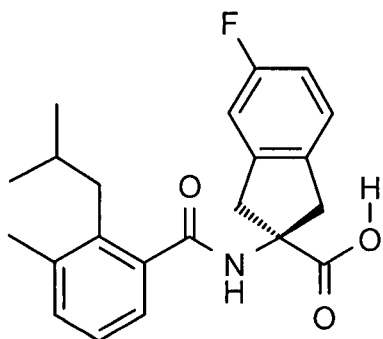
ácido 5-bromo-2-[3-metil-2-((E)-propenil)-benzoilamino]-
 indan-2-carboxílico,
 ácido 2-[(2-cloro-6-metil-benzoil)-amino]-indan-2-
 carboxílico,
 ácido 2-[(2-metiltiolbencen-1-carbonil)-amino]-indan-2-
 carboxílico,
 ácido 2-(5-cloro-2-ciclobutoxi-3-metil-benzoilamino)-indan-
 2-carboxílico,
 ácido 2-(2-isobutiril-3-metil-benzoilamino)-indan-2-
 carboxílico,
 ácido 2-(2,3-dimetil-benzoilamino)-indan-2-carboxílico,
 ácido 2-(3-ciano-2-metil-benzoilamino)-indan-2-carboxílico,
 ácido 2-[(bifenil-2-carbonil)-amino]-indan-2-carboxílico,
 ácido 2-[2-(1,1-dimetil-propil)-benzoilamino]-indan-2-
 carboxílico,
 ácido 2-(2-ciclobutoxi-3-metil-benzoilamino)-4,5-dicloro-
 indan-2-carboxílico,
 ácido 2-(2-ciclobutoxi-3-metil-benzoilamino)-5-cloro-indan-
 2-carboxílico,
 ácido 2-(2-ciclobutoxi-3-metil-benzoilamino)-4-fluoro-indan-
 2-carboxílico,
 ácido 2-(2-ciclobutiloxi-3-metilbenzoilamino)indan-2-
 acético,
 ácido 2-(3-bromo-2-metilbenzoilamino)indan-2-carboxílico,
 ácido 2-(5-bromo-2-ciclobutoxi-3-metil-benzoilamino)-indan-
 2-carboxílico,
 ácido 2-(2-isopropilsulfanil-benzoilamino)-indan-2-
 carboxílico,
 ácido 2-(5-cloro-2-ciclobutoxi-3-metil-benzoilamino)-5-
 fluoro-indan-2-carboxílico,
 ácido 2-[[2-(etil-metil-amino)-piridina-3-carbonil]-amino]-
 indan-2-carboxílico,
 ácido 2-[[2-(alil-metil-amino)-piridina-3-carbonil]-amino]-
 indan-2-carboxílico,
 ácido 2-[[2-(isopropil-metil-amino)-piridina-3-carbonil]-
 amino]-indan-2-carboxílico,
 ácido 2-[[5-cloro-2-(isopropil-metil-amino)-piridina-3-
 carbonil]-amino]-indan-2-carboxílico,

625

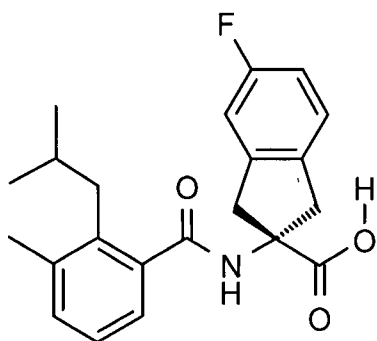
ácido 4,5-difluoro-2-[3-metil-2-(2-metil-propenil)-benzoilamino]-indan-2-carboxílico,
 ácido 4,5-difluoro-2-(2-isobutil-3-metil-benzoilamino)-indan-2-carboxílico,
 ácido 4,7-difluoro-2-[3-metil-2-(2-metil-propenil)-benzoilamino]-indan-2-carboxílico,
 ácido 4,7-difluoro-2-(2-isobutil-3-metil-benzoilamino)-indan-2-carboxílico,
 ácido 5-cloro-2-(2-isobutil-3-metil-benzoilamino)-indan-2-carboxílico,
 ácido 5-cloro-2-[3-metil-2-(2-metil-propenil)-benzoilamino]-indan-2-carboxílico,
 ácido 2-(5,6,7,8-tetrahidro-naftalen-1-ilcarbamoil)-indan-2-carboxílico,
 2-ciclobutoxi-N-(2-metanosulfonilaminocarbonil-indan-2-il)-3-metil-benzamida,
 2-ciclobutoxi-3-metil-N-(2-trifluorometanosulfonilaminocarbonil-indan-2-il)-benzamida,
 2-ciclopent-1-enil-3-metil-N-(2-trifluorometanosulfonilaminocarbonil-indan-2-il)-benzamida,
 2-ciclobutoxi-3-metil-N-[2-(1H-tetrazol-5-il)-indan-2-il]-benzamida, y
 ácido 2-[2-(2-Metil-propenil)-3-trifluorometil-benzoilamino]-indan-2-carboxílico, o

una forma estereoisomérica del mismo, una mezcla de formas estereoisoméricas del mismo en cualquier proporción o una sal fisiológicamente aceptable del mismo.

12. El compuesto según la reivindicación 1 de la siguiente estructura.



13. El compuesto según la reivindicación 1 de la siguiente estructura.



14. Una composición farmacéutica que comprende una cantidad farmacéuticamente aceptable de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 y al menos uno de un excipiente farmacéuticamente aceptable y un vehículo farmacéuticamente aceptable.
15. Un método para el tratamiento de un paciente que padece de, o que es propenso a, una afección fisiológica que puede mejorarse por la administración de una cantidad farmacéuticamente eficaz de un inhibidor del receptor CXCR5 al paciente, que comprende administrar el compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 a dicho paciente.
16. El método de acuerdo con la reivindicación 15 en el que la afección fisiológica es una enfermedad inflamatoria.
17. El método de acuerdo con la reivindicación 15 en el que la afección fisiológica es artritis reumatoide.
18. El método de acuerdo con la reivindicación 15 en el que la afección fisiológica es asma.
19. El método de la reivindicación 15 en el que con el compuesto de la reivindicación 1 se administra con otro agente terapéutico al mismo tiempo o de manera secuencial.

20. Un proceso para producir un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 como se describe en la presente memoria.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 10 - 17,885
FECHA : MARZO 6 DE 2010

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-123805- -00002-0000

Fecha: 2010-03-25 18:03:26 Dep: 2020 DIR.NULVASCR
Ira. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 12

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PBO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	325689696	08/03/2010	25,696,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LEMAS COMERCIALES	114,000.00
		TOTAL :	\$ 114,000.00

SON: CIENTO CATORCE MIL PESOS

RESPONSABLE

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

0000: 14775 - 841 - 106 - 9.

67A