

OLARTE RAISBECK


Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicación: 02101292 00000002

Folios: 17

Fecha (RD): 2004-11-29 17:15:24

Trámite: 011 PCT-PATENT 379 FASE NACI 329 COMPLET

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

SOLICITUD DE:

1

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Solicitud.

2

SOLICITANTE
(71)

Nombre: PFIZER INC.

Dirección: 235 East 42nd Street, New York,
NY, Estados Unidos de América.

Nacionalidad o Domicilio: ESTADOUNIDENSE

Lugar de Constitución: Estados Unidos de
América.

Teléfono: _____

Fax: _____

E-mail: _____

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número _____

3

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: CARLOS R. OLARTE

Dirección: World Trade Center Torre A

Calle 100 No. 8^a-37 Piso 10, Bogotá

Teléfono: 601-7700 Fax: 601-7799

E-mail: _____

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número 79.782.747Bta
TP 74.295

4

Número de expediente:

02.101.292

5

Descripción de la corrección o modificación solicitada VER PAGINA ADJUNTA.

6

Comprobante de pago No. 91,307

Fecha Noviembre 25, 2004

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 R. OLARTE

FIRMA: _____

C.C. 79.782.747 Bta T.P. 74.295

174 *[Signature]*

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicación : 02101292 00000002 Folios: 17
Fecha (MM): 2004-11-29 17:15:24
Trámite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NNCI 329 COMPLETO
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

NIT : 900176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 04 - 91,307
FECHA : NOVIEMBRE 25 DE 2004

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
JOSE SANTOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	29810428	24/11/2004	4,587,000.00

***** CONCEPTO *****

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

SON: OCHENTA Y SIETE MIL PESOS

RESPONSABLE : *[Signature]*

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

175 3

Me permito modificar el **CAPITUL REIVINDICATORI** de la siguiente manera:

La **REIVINDICACIÓN** 23 nueva Incorpora ahora las **REIVINDICACIONES** originales 24, 25, 26, 27, 28, 29, 30, 34, 35 y 36, por ende me permito eliminar dichas relvindicaciones.

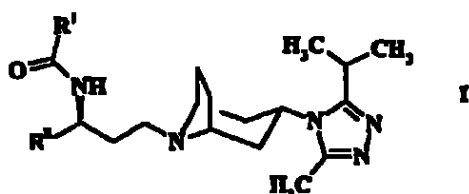
Las **REIVINDICACIONES** restantes se reenumeraron de la siguiente manera:

NUMERACIÓN REIVINDICACIÓN ORIGINAL	NUMERACIÓN REIVINDICACIÓN ACTUAL
24	31
25	32
26	33
27	37

176 H

CAPITULO REIVINDICATORIO MODIFICADO

5 1. Un compuesto de fórmula



10

en la que R¹ es un cicloalquilo C₃₋₆ opcionalmente sustituido con uno o más átomos de flúor, o alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido con uno o más átomos de flúor, o cicloalquil (C₁₋₆)metilo opcionalmente sustituido en el anillo con uno o más átomos de flúor;

15

y

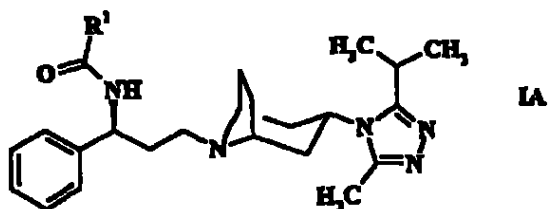
R² es un fenilo opcionalmente sustituido con uno o más átomos de flúor;

o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de éste.

20

2. Un compuesto según la reivindicación 1 de fórmula

25



5

en la que R^1 representa cicloalquilo C_{3-6} opcionalmente sustituido con uno o más átomos de flúor, o alquilo C_{1-4} opcionalmente sustituido con uno o más átomos de flúor, o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de éste.

10

3. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que R^1 es cicloalquilo C_{4-6} opcionalmente sustituido con uno o dos átomos de flúor, o alquilo C_{1-4} opcionalmente sustituido con uno a tres átomos de flúor.

15

4. Un compuesto según la reivindicación 3, en el que R^1 es ciclobutilo, ciclopentilo, 4,4-difluorociclohexilo o 3,3,3-trifluoropropilo.

20

5. Un compuesto según las reivindicaciones 1, 3 ó 4, en el que R^2 es un fenilo opcionalmente sustituido con 1 ó 2 átomos de flúor.

25

6. Un compuesto según la reivindicación 5, en el que R^2 es fenilo o monofluorofenilo.

178 6

7. Un compuesto según la reivindicación 6, en el que R¹ es fenilo o 3-fluorofenilo.

8. Un compuesto según la reivindicación 1, que se selecciona del grupo constituido por:

N-{(1S)-3-[3-(3-Isopropil-5-metil-4H-1,2,4-triazol-4-il)-exo-8-azabicyclo[3.2.1]oct-8-il]-1-fenilpropil}ciclobutano-carboxamida;

N-{(1S)-3-[3-(3-Isopropil-5-metil-4H-1,2,4-triazol-4-il)-exo-8-azabicyclo[3.2.1]oct-8-il]-1-fenilpropil}ciclopentanocarboxamida;

N-{(1S)-3-[3-(3-Isopropil-5-metil-4H-1,2,4-triazol-4-il)-exo-8-azabicyclo[3.2.1]oct-8-il]-1-fenilpropil}-4,4,4-trifluorobutanamida;

N-{(1S)-3-[3-(3-Isopropil-5-metil-4H-1,2,4-triazol-4-il)-exo-8-azabicyclo[3.2.1]oct-8-il]-1-fenilpropil}-4,4-difluorociclohexanocarboxamida; y

N-{(1S)-3-[3-(3-Isopropil-5-metil-4H-1,2,4-triazol-4-il)-exo-8-azabicyclo[3.2.1]oct-8-il]-1-(3-fluorofenil)propil}-4,4-difluorociclohexanocarboxamida; o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de cualquiera de éstos.

9. Una composición farmacéutica que incluye un compuesto de fórmula (I) o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de éste, según una cualquiera de las

reivindicaciones precedentes, junto con un excipiente, diluyente o vehículo farmacéuticamente aceptable.

5 10. Un compuesto de fórmula (I) o una sal, solvato o composición farmacéuticamente aceptable de éste, según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 y 9, respectivamente, para uso como medicamento.

10 11. Un compuesto de fórmula (I) o una sal, solvato o composición farmacéuticamente aceptable de éste, según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 y 9, respectivamente, para el tratamiento de una enfermedad en la que está implicada la modulación de los receptores de CCR5.

15 12. Un compuesto de fórmula (I) o una sal, solvato o composición farmacéuticamente aceptable de éste, según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 y 9, respectivamente, para el tratamiento de una infección por VIH, retroviral genéticamente relacionada con VIH, de SIDA
20 o de una enfermedad inflamatoria.

13. Un compuesto de fórmula (I) o una sal, solvato o composición farmacéuticamente aceptable de éste, según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 y 9,
25 respectivamente, para el tratamiento de una dolencia

1808

respiratoria, incluyendo síndrome del distrés respiratorio en adultos (SDRA), bronquitis, bronquitis crónica, enfermedad pulmonar obstructiva crónica, fibrosis quística, asma, enfisema, rinitis o sinusitis crónica.

5

14. Un compuesto de fórmula (I) o una sal, solvato o composición farmacéuticamente aceptable de éste, según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 y 9, respectivamente, para el tratamiento de una enfermedad inflamatoria del intestino, incluyendo enfermedad de Crohn y colitis ulcerosa, esclerosis múltiple, artritis reumatoide, rechazo de injertos, incluyendo aloinjertos de riñón y pulmón, endometriosis, diabetes de tipo I, enfermedades renales, pancreatitis crónica, afecciones pulmonares inflamatorias o insuficiencia cardíaca crónica.

15

15. El uso de un compuesto de fórmula (I) o de una sal, solvato o composición farmacéuticamente aceptable de éste, según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 y 9, respectivamente, para la fabricación de un medicamento para el tratamiento de una enfermedad en la que está implicada la modulación de los receptores de CCR5.

20

16. El uso de un compuesto de fórmula (I) o de una sal, solvato o composición farmacéuticamente aceptable de éste,

25

según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 y 9, respectivamente, para la fabricación de un medicamento para el tratamiento de una infección por VIH, retroviral genéticamente relacionada con VIH, de SIDA o de una enfermedad inflamatoria.

17. El uso de un compuesto de fórmula (I) o de una sal, solvato o composición farmacéuticamente aceptable de éste, según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 y 9, respectivamente, para la fabricación de un medicamento para el tratamiento de una dolencia respiratoria, incluyendo síndrome del distrés respiratorio en adultos (SDRA), bronquitis, bronquitis crónica, enfermedad pulmonar obstructiva crónica, fibrosis quística, asma, enfisema, rinitis o sinusitis crónica.

18. El uso de un compuesto de fórmula (I) o una sal, solvato o composición farmacéuticamente aceptable de éste, según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 y 9, respectivamente, para la fabricación de un medicamento para el tratamiento de una enfermedad inflamatoria del intestino, incluyendo enfermedad de Crohn y colitis ulcerosa, esclerosis múltiple, artritis reumatoide, rechazo de injertos, incluyendo aloinjertos de riñón y pulmón, endometriosis, diabetes de tipo I, enfermedades renales, pancreatitis

102
40

crónica, afecciones pulmonares inflamatorias o insuficiencia cardiaca crónica.

5 19. Un procedimiento de tratamiento de un mamífero para tratar una enfermedad en la que está implicada la modulación de los receptores de CCR5, que incluye el tratamiento de dicho mamífero con una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula (I) o con una sal, solvato o composición farmacéuticamente aceptable de éste según una cualquiera de
10 las reivindicaciones 1 a 8 y 9, respectivamente.

15 20. Un procedimiento de tratamiento de un mamífero para tratar una infección por VIH, retroviral genéticamente relacionada con VIH, SIDA o una enfermedad inflamatoria, que incluye el tratamiento de dicho mamífero con una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula (I) o con una sal, solvato o composición farmacéuticamente aceptable de éste según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 y 9, respectivamente.

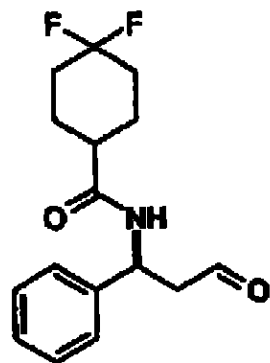
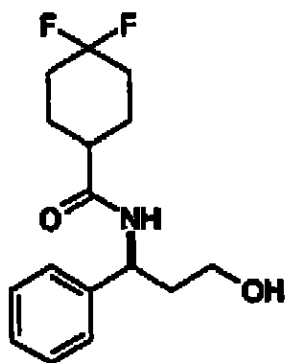
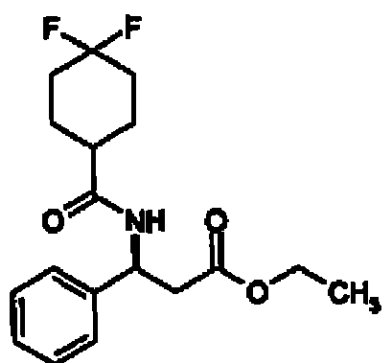
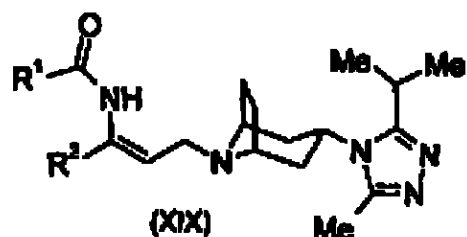
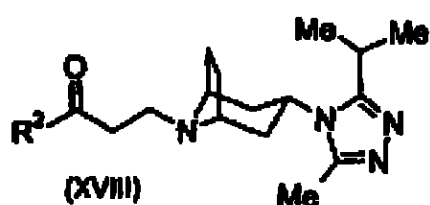
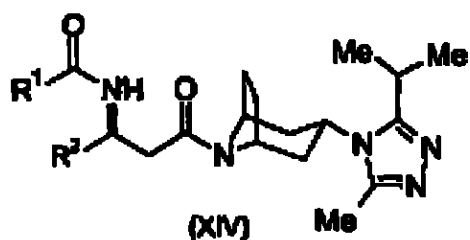
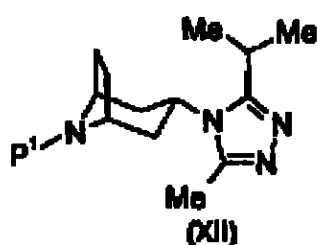
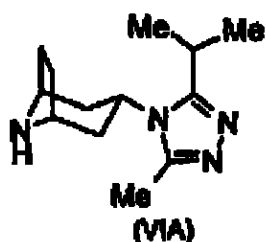
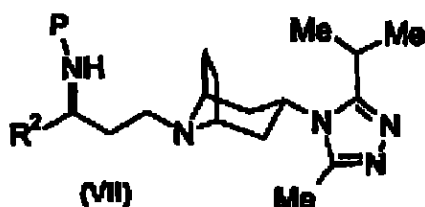
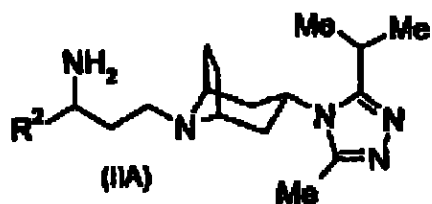
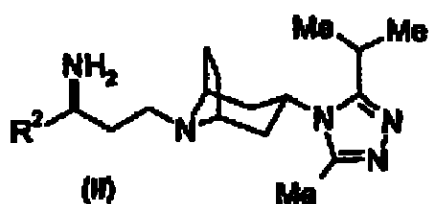
20

21. Un procedimiento de tratamiento de un mamífero para tratar una dolencia respiratoria, incluyendo síndrome del distrés respiratorio en adultos (SDRA), bronquitis, bronquitis crónica, enfermedad pulmonar obstructiva crónica,
25 fibrosis quística, asma, enfisema, rinitis o sinusitis

crónica, que incluye el tratamiento de dicho mamífero con una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula (I) o con una sal, solvato o composición farmacéuticamente aceptable de éste según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 y 9, respectivamente.

22. Un procedimiento de tratamiento de un mamífero para tratar una enfermedad inflamatoria del intestino, incluyendo enfermedad de Crohn y colitis ulcerosa, esclerosis múltiple, artritis reumatoide, rechazo de injertos, incluyendo aloinjertos de riñón y pulmón, endometriosis, diabetes de tipo I, enfermedades renales, pancreatitis crónica, afecciones pulmonares inflamatorias o insuficiencia cardíaca crónica, que incluye el tratamiento de dicho mamífero con una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula (I) o con una sal, solvato o composición farmacéuticamente aceptable de éste según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 y 9, respectivamente.

23. Un compuesto de fórmula:



donde R^1 y R^2 son tal como se definió en la reivindicación 1,
 P es un grupo protector, P^1 es un grupo protector;
 o una sal del mismo del compuesto de fórmula (VIA),
 preferiblemente una sal p-toluensulfato.

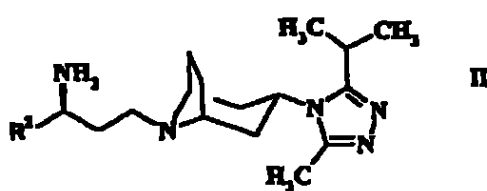
24. Un compuesto según la reivindicación 23 donde R^2 es fenilo.

25. Un compuesto según la reivindicación 23 donde P^1 es bencilo.

26. Un compuesto según las reivindicaciones 23 o 24 donde P es t-butiloxicarbonilo o benciloxicarbonilo.

27. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula (I) según la reivindicación 1, que comprende

(a) acoplamiento de un compuesto de fórmula:



con un compuesto de fórmula:



en las que R^1 y R^2 son como se definieron para un compuesto de fórmula (I); o

5

(b) reacción de un compuesto de fórmula (II) con un compuesto de fórmula

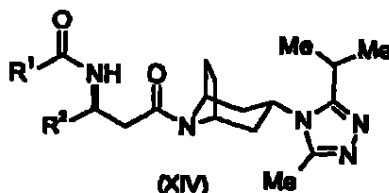


10

en la que Z es un grupo activador de ácido carboxílico; o

(c) reducción de un compuesto de fórmula:

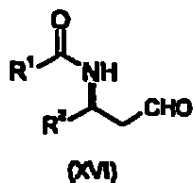
15



en la que R^1 y R^2 son como se definieron para un compuesto de fórmula (I);

20

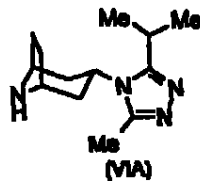
(d) aminación reductora utilizando un compuesto de fórmula:



25

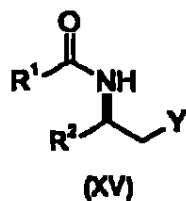
107 S

en la que R¹ y R² son como se definieron para un compuesto de fórmula (I), y un compuesto de fórmula:



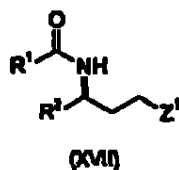
o una sal de éste; o

(e) aminación reductora utilizando un compuesto de fórmula:



en la que Y es CN y R¹ y R² son como se definieron para un compuesto de fórmula (I), y un compuesto de fórmula (VIA) o una sal de éste; o

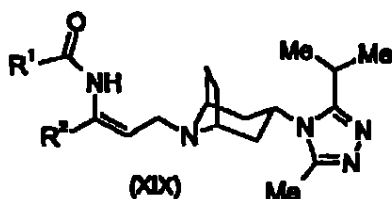
(f) alquilación de un compuesto de fórmula (VIA), o de una sal de éste, con un compuesto de fórmula:



en la que Z^1 es un grupo saliente y R^1 y R^2 son como se definieron para un compuesto de fórmula (I); o

(g) reducción asimétrica de un compuesto de fórmula:

5



10 en la que R^1 y R^2 son como se definieron para un compuesto de fórmula (I); o

(h) reacción de un compuesto de fórmula (II), o de una sal metálica de éste, con un compuesto de fórmula:

15

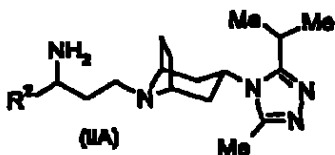


20 en la que R^1 es como se definió anteriormente para un compuesto de fórmula (I) y R^3 es un grupo formador de éster; o

(i) reacción de un compuesto de fórmula:

25

189 17



5 con un compuesto de fórmula (III) en condiciones acoplantes,
o con un compuesto de fórmula (VIB), y en presencia de un
catalizador quirral;

estando seguidos cualquiera de los citados procedimientos,
10 opcionalmente, por la conversión de un compuesto de fórmula
(I) en una sal farmacéuticamente aceptable de éste.