

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E S D.

145

SUPERINTENDENCIA Y COMERCIO	
Indicación : 04-043.370 GENERAL	Folios : 7
Fecha (MP): 22-02-10 16:19:39	
Trámite : 011 PCT-PANAM 279 FINE 0001 SIN PETICION	
Dependencia : 0000 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES	

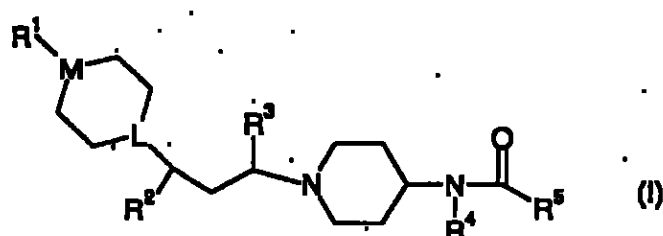
Re **P1.-ASTRAZENECA AB.-Solicitud de Patente de Invención en Fase Nacional PCT para "DERIVADOS DE PIPERIDINA Y SU USO COMO MODULADORES DE LA ACTIVIDAD DEL RECEPTOR QUININOQUINA (ESPECIALMENTE EL CCBE)".-Clase A61K 31/445; A61K 31/4523 - Expediente número 04-043.370 -**

1 Me refiero a mi memorial de 14 de Septiembre de 2004

2 De conformidad con lo dispuesto en el Artículo 5 2 12 de la Circular Externa No 03 de 28 de Abril de 2003, y estando dentro del plazo de seis meses contados desde la fecha de la publicación de la solicitud en la Gaceta de la Propiedad Industrial número 543 de 1 de Septiembre de 2004, solicito a ese Despacho proceder a realizar el examen de patentabilidad de la presente Invención

3 Por otro lado, atentamente me permito manifestar a usted que en el extracto de la solicitud arriba nombrada, publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial número 543 de 1 de Septiembre de 2004, página 413, la reivindicación número 1 aparece publicada en forma equivocada, debido a que la reivindicación número 1 correcta es como sigue a continuación

Un compuesto de fórmula (I)



en donde

L es CH o N; M es CH o N; siempre y cuando L y M no sean CH ambas;

R¹ es Hidrógeno, alquiloC₁₋₆ [opcionalmente sustituido por fenilo {a su vez opcionalmente sustituido por halo, alquiloC₁₋₄, alcoxiC₁₋₄, ciano, nitro, CF₃, OCF₃, (alquiloC₁₋₄)C(O)NH, S(O)₂NH₂, alquiltioC₁₋₄, S(O)(alquiloC₁₋₄) o S(O)₂(alquiloC₁₋₄)} o heteroarilo {a su vez opcionalmente sustituido por halo, alquiloC₁₋₄, alcoxiC₁₋₄, ciano, nitro, CF₃, (alquiloC₁₋₄)C(O)NH, S(O)₂NH₂, alquiltioC₁₋₄, S(O)(alquiloC₁₋₄) o S(O)₂(alquiloC₁₋₄)}, fenilo {opcionalmente sustituido por halo, alquiloC₁₋₄, alcoxiC₁₋₄, ciano, nitro, CF₃, OCF₃,

(alquiloC₁₋₄)C(O)NH, S(O)₂NH₂, alquiltioC₁₋₄, S(O)(alquiloC₁₋₄) o S(O)₂(alquiloC₁₋₄)}, heteroarilo {opcionalmente sustituido por halo, alquiloC₁₋₄, alcoxiC₁₋₄, ciano, nitro, CF₃, (alquiloC₁₋₄)C(O)NH, S(O)₂NH₂, alquiltioC₁₋₄, S(O)(alquiloC₁₋₄) o S(O)₂(alquiloC₁₋₄)}, S(O)₂R⁶, S(O)₂NR¹⁰R¹¹, C(O)R⁷, C(O)₂(alquiloC₁₋₆), C(O)₂(fenil(alquiloC₁₋₂)) o C(O)NHR⁷; y cuando M es CH, R¹ también puede ser NHS(O)₂R⁶, NHS(O)₂NHR⁷, NHC(O)R⁷ o NHC(O)NHR⁷;

R² es fenilo o heteroarilo, cualquiera está opcionalmente sustituido por halo,

alquiloC₁₋₄, alcoxiC₁₋₄, S(O)_n(alquiloC₁₋₄), nitro, ciano, o CF₃;

R³ es hidrógeno o alquiloC₁₋₄;

R⁴ es hidrógeno, metilo, etilo, alilo o ciclopropilo;

R⁵ es fenilo, heteroarilo, feniloNH, heteroariloNH, fenilo-alquilo(C₁₋₂), heteroarilo-alquilo(C₁₋₂), fenilo-alquilo(C₁₋₂)NH o heteroarilo-alquilo(C₁₋₂)NH; en donde los anillos de fenilo y heteroarilo de R⁵ están opcionalmente sustituidos por halo, ciano, nitro, hidroxilo, alquiloC₁₋₄, alcoxiC₁₋₄, S(O)_kalquiloC₁₋₄, S(O)₂NR⁸R⁹, NHS(O)₂(alquiloC₁₋₄), NH₂, NH(alquiloC₁₋₄), N(alquiloC₁₋₄)₂, NHC(O)NH₂, C(O)NH₂, C(O)NH(alquiloC₁₋

142

4), $\text{NHC(O)(alquiloC}_{1-4}\text{)}$, CO_2H , $\text{CO}_2(\text{alquiloC}_{1-4})$, $\text{C(O)(alquiloC}_{1-4}\text{)}$, CF_3 , CHF_2 , CH_2F , CH_2CF_3 o OCF_3 ;

k, m y n son, independientemente 0, 1 o 2;

R^6 es alquiloC_{1-6} [opcionalmente sustituido por halo, alcoxiC_{1-4} , fenilo {que a su vez está opcionalmente sustituido por halo, alquiloC_{1-4} , alcoxiC_{1-4} , ciano, nitro, CF_3 , OCF_3 , $(\text{alquiloC}_{1-4})\text{C(O)NH}$, $\text{S(O)}_2\text{NH}_2$, alquiltioC_{1-4} , $\text{S(O)(alquiloC}_{1-4}\text{)}$ o $\text{S(O)}_2(\text{alquiloC}_{1-4}\text{})$ } o heteroarilo {a su vez opcionalmente sustituido por halo, alquiloC_{1-4} , alcoxiC_{1-4} , ciano, nitro, CF_3 , $(\text{alquiloC}_{1-4})\text{C(O)NH}$, $\text{S(O)}_2\text{NH}_2$, alquiltioC_{1-4} , $\text{S(O)(alquiloC}_{1-4}\text{)}$ o $\text{S(O)}_2(\text{alquiloC}_{1-4}\text{})$ }, cicloalquilo C_{3-7} , piranilo, fenilo {opcionalmente sustituido por halo, alquiloC_{1-4} , alcoxiC_{1-4} , ciano, nitro, CF_3 , OCF_3 , $(\text{alquiloC}_{1-4})\text{C(O)NH}$, $\text{S(O)}_2\text{NH}_2$, alquiltioC_{1-4} , $\text{S(O)(alquiloC}_{1-4}\text{)}$ o $\text{S(O)}_2(\text{alquiloC}_{1-4}\text{})$ } o heteroarilo {opcionalmente sustituido por halo, alquiloC_{1-4} , alcoxiC_{1-4} , ciano, nitro, CF_3 , $(\text{alquiloC}_{1-4})\text{C(O)NH}$, $\text{S(O)}_2\text{NH}_2$, alquiltioC_{1-4} , $\text{S(O)(alquiloC}_{1-4}\text{)}$ o $\text{S(O)}_2(\text{alquiloC}_{1-4}\text{})$ };

R^7 es hidrógeno, alquiloC_{1-6} [opcionalmente sustituido por halo, alcoxiC_{1-4} , fenilo {que a su vez está opcionalmente sustituido por halo, alquiloC_{1-4} , alcoxiC_{1-4} , ciano, nitro, CF_3 , OCF_3 , $(\text{alquiloC}_{1-4})\text{C(O)NH}$, $\text{S(O)}_2\text{NH}_2$, alquiltioC_{1-4} , $\text{S(O)(alquiloC}_{1-4}\text{)}$ o $\text{S(O)}_2(\text{alquiloC}_{1-4}\text{})$ } o heteroarilo {que a su vez está opcionalmente sustituido por halo, alquiloC_{1-4} , alcoxiC_{1-4} , ciano, nitro, CF_3 , $(\text{alquiloC}_{1-4})\text{C(O)NH}$, $\text{S(O)}_2\text{NH}_2$, alquiltioC_{1-4} , $\text{S(O)(alquiloC}_{1-4}\text{)}$ o $\text{S(O)}_2(\text{alquiloC}_{1-4}\text{})$ }, cicloalquilo C_{3-7} , piranilo, fenilo {opcionalmente sustituido por halo, alquiloC_{1-4} , alcoxiC_{1-4} , ciano, nitro, CF_3 , OCF_3 , $(\text{alquiloC}_{1-4})\text{C(O)NH}$, $\text{S(O)}_2\text{NH}_2$, alquiltioC_{1-4} , $\text{S(O)(alquiloC}_{1-4}\text{)}$ o $\text{S(O)}_2(\text{alquiloC}_{1-4}\text{})$ } o heteroarilo {opcionalmente sustituido por halo, alquiloC_{1-4} , alcoxiC_{1-4} , ciano, nitro, CF_3 , $(\text{alquiloC}_{1-4})\text{C(O)NH}$, $\text{S(O)}_2\text{NH}_2$, alquiltioC_{1-4} , $\text{S(O)(alquiloC}_{1-4}\text{)}$ o $\text{S(O)}_2(\text{alquiloC}_{1-4}\text{})$ };

R^8 y R^9 son, independientemente, hidrógeno o alquiloC_{1-4} , o junto con un átomo de nitrógeno u oxígeno, puede unirse para formar un anillo de 5- o 6- miembros que está opcionalmente sustituido con alquiloC_{1-4} , C(O)H o $\text{C(O)(alquiloC}_{1-4}\text{)}$;

R^{10} y R^{11} son, independientemente, hidrógeno o alquiloC_{1-4} , o puede unirse para formar un anillo de 5- o 6- miembros que está opcionalmente sustituido con alquiloC_{1-4} o fenilo (en donde el anillo de fenilo está

opcionalmente sustituido por halo, ciano, nitro, hidroxí, alquiloC₁₋₄, alcoxiC₁₋₄,

S(O)_malquiloC₁₋₄, S(O)₂NH₂, S(O)₂NH(alquiloC₁₋₄); S(O)₂N(alquiloC₁₋₄)₂; NHS(O)₂(alquiloC₁₋₄); NH₂; NH(alquiloC₁₋₄), N(alquiloC₁₋₄)₂; NHC(O)NH₂, C(O)NH₂, C(O)NH(alquiloC₁₋₄), NHC(O)(alquiloC₁₋₄), CO₂H, CO₂(alquiloC₁₋₄), CO(alquiloC₁₋₄), CF₃, CHF₂, CH₂F, CH₂CF₃ u OCF₃);

o una sal farmacéuticamente aceptable de estos o un solvato de estos;

y cuando que, cuando R¹ es hidrógeno o alquilo no sustituido, R⁴ es hidrógeno, metilo o etilo, L es CH y M es N, la parte del fenilo o heteroarilo de R⁵ está sustituido por uno de: S(O)_kalquiloC₁₋₄, NHC(O)NH₂, C(O)(alquiloC₁₋₄), CHF₂, CH₂F, CH₂CF₃ u OCF₃; y opcionalmente adicionalmente sustituido por uno o más de halo, ciano, nitro, hidroxí, alquiloC₁₋₄, alcoxiC₁₋₄, S(O)_kalquiloC₁₋₄, S(O)₂NR⁸R⁹, NHS(O)₂(alquiloC₁₋₄); NH₂; NH(alquiloC₁₋₄), N(alquiloC₁₋₄)₂; NHC(O)NH₂, C(O)NH₂, C(O)NH(alquiloC₁₋₄), NHC(O)(alquiloC₁₋₄), CO₂H, CO₂(alquiloC₁₋₄), C(O)(alquiloC₁₋₄), CF₃, CHF₂, CH₂F, CH₂CF₃ u OCF₃;

4. En vista de lo anterior, muy comedidamente solicito a usted que las aclaraciones correspondientes sean incluidas en la Fe de Erratas de la próxima Gaceta de la Propiedad Industrial.

5. Me permito recordar a usted, que tal como se informó en el Petitorio de la Invención, la presente solicitud corresponde a Capítulo II.

6 Anexo me permito presentar:

- (a) Recibo número 05-11.202, expedido por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago de la tasa que dicho examen causa; y
- (b) Copia del extracto de la solicitud, tal como fue presentado a ese Despacho con mi solicitud de 11 de Mayo de 2004.

7. Ruego a usted tomar atenta nota de lo anterior y proceder de conformidad.

Señor Superintendente,


ALICIA LLOREDA RICAURTE
T.P. 53.215

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 000174009-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 05 - 11,202
FECHA : FEBRERO 14 DE 2003

SUPERINTENDENCIA Y COMERCIO
Radicacion : 01042370 DECEMBER
Fecha CREO : 2003-02-10 16:45:29
Tracta : 011 PTC-POTENT 379 FINE DEC 579 PETITEN
Superintendencia DE INDUSTRIA Y COMERCIO

CONSIGNACION

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	W. PAGO
LLORENZO Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	000-00110-6	30342372	14/02/2003	0,479,000.00

CONCEPTO

CANT. HISTORICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 2000-01-01 SOLICITUDES	114 PTC CAP-11 EXAMEN DE PATENTABILIDAD	106,000.00
	TOTAL :	0 106,000.00

SUM: CIENTO OCHENTA Y SEIS MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

No. SOLICITUD
INTERNACIONAL : PCT/SE02/02055

(51) INT. CL.: C07D 401/06

(21) No. SOLICITUD:

(22) FECHA DE
PRESENTACIÓN: 11-05-2004

(71) SOLICITANTE: **ASTRAZENECA AB**

(30) PRIORIDAD:

(31) No. DE SOLICITUD: 0103818-1

(72) INVENTOR/ES: TUCKER, Howard.

(32) FECHA DE
PRESENTACIÓN: 15-11-2001

(33) PAÍS: SE

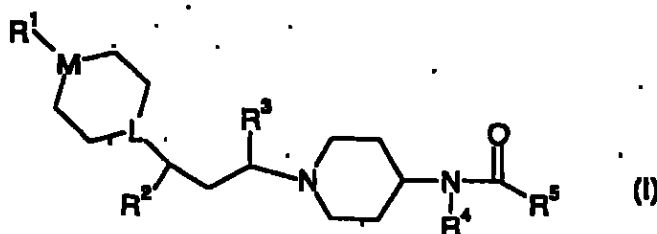
(74) REPRESENTANTE
LEGAL: JOSE ANTONIO LLOREDA

(54) TÍTULO:
**DERIVADOS DE PIPERIDINA Y SU USO COMO MODULADORES DE LA ACTIVIDAD DEL RECEPTOR
QUIMOQUINA (ESPECIALMENTE CCR5)**

(57) RESUMEN:

Reivindicación número 1.-

Un compuesto de formula (I):



en donde

L es CH o N; M es CH o N; siempre y cuando L y M no sean CH ambas;

R¹ es Hidrógeno, alquiloC₁₋₄ [opcionalmente sustituido por fenilo {a su vez opcionalmente sustituido por halo, alquiloC₁₋₄, alcoxiC₁₋₄, ciano, nitro, CF₃, OCF₃, (alquiloC₁₋₄)C(O)NH, S(O)₂NH₂, alquiltioC₁₋₄, S(O)(alquiloC₁₋₄) o S(O)₂(alquiloC₁₋₄)} o heteroarilo {a su vez opcionalmente sustituido por halo, alquiloC₁₋₄, alcoxiC₁₋₄, ciano, nitro, CF₃, (alquiloC₁₋₄)C(O)NH, S(O)₂NH₂, alquiltioC₁₋₄, S(O)(alquiloC₁₋₄) o S(O)₂(alquiloC₁₋₄)}, fenilo {opcionalmente sustituido por halo, alquiloC₁₋₄, alcoxiC₁₋₄, ciano, nitro, CF₃, OCF₃,

(alquiloC₁₋₄)C(O)NH, S(O)₂NH₂, alquiltioC₁₋₄, S(O)(alquiloC₁₋₄) o S(O)₂(alquiloC₁₋₄), heteroarilo {opcionalmente sustituido por halo, alquiloC₁₋₄, alcoxiC₁₋₄, ciano, nitro, CF₃, (alquiloC₁₋₄)C(O)NH, S(O)₂NH₂, alquiltioC₁₋₄, S(O)(alquiloC₁₋₄) o S(O)₂(alquiloC₁₋₄)}, S(O)₂R⁸, S(O)₂NR¹⁰R¹¹, C(O)R⁷, C(O)₂(alquiloC₁₋₄), C(O)₂(fenil(alquiloC₁₋₂)) o C(O)NHR⁷; y cuando M es CH, R¹ también puede ser NHS(O)₂R⁸, NHS(O)₂NHR⁷, NHC(O)R⁷ o NHC(O)NHR⁷;

R² es fenilo o heteroarilo, cualquiera está opcionalmente sustituido por halo, alquiloC₁₋₄, alcoxiC₁₋₄, S()_n(alquiloC₁₋₄), nitro, ciano, o CF₃;

R³ es hidrógeno o alquiloC₁₋₄;

R⁴ es hidrógeno, metilo, etilo, alilo o ciclopropilo;

R^5 es fenilo heteroarilo feniloNH heteroariloNH fenilo-alquilo(C_{1-2}) heteroarilo-alquilo(C_{1-2}) fenilo-alquilo(C_{1-2})NH o heteroarilo-alquilo(C_{1-2})NH en donde los anillos de fenilo y heteroarilo de R^5 están opcionalmente sustituidos por halo ciano nitrógeno hidroxilo alquilo(C_{1-4}) alcoxi(C_{1-4}) $S(O)_x$ alquilo(C_{1-4}) $S(O)_2NR^8R^9$ $NHS(O)_2$ (alquilo(C_{1-4})) NH_2 NH (alquilo(C_{1-4})) N (alquilo(C_{1-4})) $_2$ $NHC(O)NH_2$ $C(O)NH_2$ $C(O)NH$ (alquilo(C_{1-4})) $NHC(O)$ (alquilo(C_{1-4})) CO_2H CO_2 (alquilo(C_{1-4})) $C(O)$ (alquilo(C_{1-4})) CF_3 CHF_2 CH_2F CH_2CF_3 o OCF_3

k m y n son independientemente 0 1 o 2

R^6 es alquilo(C_{1-4}) [opcionalmente sustituido por halo alcoxi(C_{1-4}) fenilo {que a su vez está opcionalmente sustituido por halo alquilo(C_{1-4}) alcoxi(C_{1-4}) ciano nitrógeno CF_3 OCF_3 , (alquilo(C_{1-4})) $C(O)NH$ $S(O)_2NH_2$ alquilo(C_{1-4}) $S(O)$ (alquilo(C_{1-4})) o $S(O)_2$ (alquilo(C_{1-4}))} o heteroarilo {a su vez opcionalmente sustituido por halo alquilo(C_{1-4}) alcoxi(C_{1-4}) ciano nitrógeno CF_3 (alquilo(C_{1-4})) $C(O)NH$ $S(O)_2NH_2$ alquilo(C_{1-4}) $S(O)$ (alquilo(C_{1-4})) o $S(O)_2$ (alquilo(C_{1-4}))} cicloalquilo(C_{3-7}) piranilo fenilo {opcionalmente sustituido por halo alquilo(C_{1-4}) alcoxi(C_{1-4}) ciano nitrógeno CF_3 OCF_3 (alquilo(C_{1-4})) $C(O)NH$ $S(O)_2NH_2$ alquilo(C_{1-4}) $S(O)$ (alquilo(C_{1-4})) o $S(O)_2$ (alquilo(C_{1-4}))} o heteroarilo {opcionalmente sustituido por halo alquilo(C_{1-4}) alcoxi(C_{1-4}) ciano nitrógeno CF_3 (alquilo(C_{1-4})) $C(O)NH$ $S(O)_2NH_2$ alquilo(C_{1-4}) $S(O)$ (alquilo(C_{1-4})) o $S(O)_2$ (alquilo(C_{1-4}))}

R^7 es hidrógeno alquilo(C_{1-4}) [opcionalmente sustituido por halo alcoxi(C_{1-4}) fenilo {que a su vez está opcionalmente sustituido por halo alquilo(C_{1-4}) alcoxi(C_{1-4}) ciano nitrógeno CF_3 OCF_3 (alquilo(C_{1-4})) $C(O)NH$ $S(O)_2NH_2$ alquilo(C_{1-4}) $S(O)$ (alquilo(C_{1-4})) o $S(O)_2$ (alquilo(C_{1-4}))} o heteroarilo {que a su vez está opcionalmente sustituido por halo alquilo(C_{1-4}) alcoxi(C_{1-4}) ciano nitrógeno CF_3 (alquilo(C_{1-4})) $C(O)NH$ $S(O)_2NH_2$ alquilo(C_{1-4})

$S(O)$ (alquilo(C_{1-4})) o $S(O)_2$ (alquilo(C_{1-4}))} cicloalquilo(C_{3-7}) piranilo fenilo {opcionalmente sustituido por halo alquilo(C_{1-4}) alcoxi(C_{1-4}) ciano nitrógeno CF_3 OCF_3 (alquilo(C_{1-4})) $C(O)NH$ $S(O)_2NH_2$ alquilo(C_{1-4}) $S(O)$ (alquilo(C_{1-4})) o $S(O)_2$ (alquilo(C_{1-4}))} o heteroarilo {opcionalmente sustituido por halo alquilo(C_{1-4}) alcoxi(C_{1-4}) ciano nitrógeno CF_3 (alquilo(C_{1-4})) $C(O)NH$ $S(O)_2NH_2$ alquilo(C_{1-4}) $S(O)$ (alquilo(C_{1-4})) o $S(O)_2$ (alquilo(C_{1-4}))}

R^8 y R^9 son independientemente hidrógeno o alquilo(C_{1-4}) o junto con un átomo de nitrógeno u oxígeno puede unirse para formar un anillo de 5- o 6- miembros que está opcionalmente sustituido con alquilo(C_{1-4}) $C(O)H$ o $C(O)$ (alquilo(C_{1-4}))

R^{10} y R^{11} son independientemente hidrógeno o alquilo(C_{1-4}) o puede unirse para formar un anillo de 5- o 6- miembros que está opcionalmente sustituido con alquilo(C_{1-4}) o fenilo (en donde el anillo de fenilo está opcionalmente sustituido por halo ciano nitrógeno hidroxilo alquilo(C_{1-4}) alcoxi(C_{1-4})

$S(O)_m$ alquilo(C_{1-4}) $S(O)_2NH_2$ $S(O)_2NH$ (alquilo(C_{1-4})) $S(O)_2N$ (alquilo(C_{1-4})) $_2$ $NHS(O)_2$ (alquilo(C_{1-4})) NH_2 NH (alquilo(C_{1-4})) N (alquilo(C_{1-4})) $_2$ $NHC(O)NH_2$ $C(O)NH_2$ $C(O)NH$ (alquilo(C_{1-4})) $NHC(O)$ (alquilo(C_{1-4})) CO_2H CO_2 (alquilo(C_{1-4})) CO (alquilo(C_{1-4})) CF_3 , CHF_2 CH_2F CH_2CF_3 u OCF_3)

o una sal farmacéuticamente aceptable de estos o un solvato de estos

siempre y cuando que cuando R^1 es hidrógeno o alquilo no sustituido R^4 es hidrógeno metilo o etilo L es CH y M es N la parte del fenilo o heteroarilo de R^5 está sustituido por uno de $S(O)_x$ alquilo(C_{1-4}) $NHC(O)NH_2$ $C(O)$ (alquilo(C_{1-4})) CHF_2 CH_2F CH_2CF_3 u OCF_3 y opcionalmente adicionalmente sustituido por uno o más de halo ciano nitrógeno hidroxilo alquilo(C_{1-4}) alcoxi(C_{1-4}) $S(O)_x$ alquilo(C_{1-4}) $S(O)_2NR^8R^9$ $NHS(O)_2$ (alquilo(C_{1-4})) NH_2 NH (alquilo(C_{1-4})) N (alquilo(C_{1-4})) $_2$ $NHC(O)NH_2$ $C(O)NH_2$ $C(O)NH$ (alquilo(C_{1-4})) $NHC(O)$ (alquilo(C_{1-4})) CO_2H CO_2 (alquilo(C_{1-4})) $C(O)$ (alquilo(C_{1-4})) CF_3 CHF_2 CH_2F CH_2CF_3 u CF_3