

OLARTE RAISBECK



SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicación: 05077674 00000004 Folios: 13
Fecha (OMB): 2005-12-13 17:20:13
Trámite: 011 PCT-PATENT 379 FASE INCI 329 COMPLEMEN
Recepción: 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,
Estados Unidos de América.

Nacionalidad o Domicilio: ESTADOUNIDENSE
Lugar de Constitución: ESTADOUNIDENSE

Teléfono: _____

Fax: _____

E-mail: _____

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número _____

3

**REPRESENTANTE
APODERADO**

Nombre: CARLOS R. OLARTE

Dirección: World Trade Center Torre A
Calle 100 No. 8ª-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:
05.077.674

5

Descripción de la corrección o modificación solicitada Me permito modificar el
Capítulo Relvindicatorio en el cual se adicionó la Relvindicación No. 30, vale la pena
aclarar al Despacho que no se añadió materia nueva y que la adición de la presente
Relvindicación se encuentra soportada en el Capítulo Descriptivo.

6

Comprobante de pago No. 81,045

Fecha Octubre 20, 2005

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

2288
372

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 05077674 00000004 Folios: 13
Fecha (MM): 2005-12-13 17:20:13
Tramite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NDCI 329 COMPLEMEN
Deendencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 600176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 05 - 81,045
FECHA : OCTUBRE 20 DE 2005

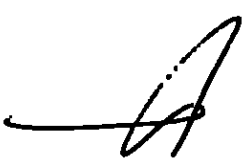
***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
OLARTE RAISDEBR	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	8370493	20/10/2005	3,817,000.00

***** C O N C E P T O *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LENAS COMERCIALES	91,000.00
		TOTAL :	91,000.00

SON: NOVENTA Y UNO MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

368
373

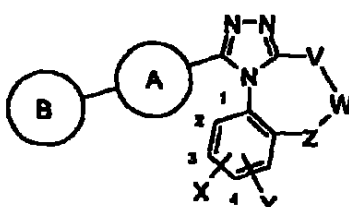
Capítulo Reivindicatorio Modificado

214

Habiendo descrito la invención como antecede, se declara, como propiedad lo contenido en las siguientes

REIVINDICACIONES

- 5 1. Un compuesto de fórmula (I),



(I)

o un derivado farmacéuticamente aceptable del mismo, donde

V representa $-(CH_2)_d(O)_e-$, $-CO-$ o $-CH(\text{alquilo } C_{1-8})-$;

W es $-O-$, $-S(O)_e-$ o $-N(R^1)-$

- 10 R^1 representa H, alquilo C_{1-8} , $(CH_2)_bCOR^2$, $CO(CH_2)_bNR^2R^3$, SO_2R^2 , $(CH_2)_cOR^2$, $(CH_2)_cNR^2R^3$ o $(CH_2)_b\text{het}^1$;

het¹ representa un heterociclo saturado o insaturado de 3 a 8 átomos que contiene uno o más heteroátomos seleccionados entre O, N o S, opcionalmente sustituido con alquilo C_{1-8} ;

- 15 X e Y representan independientemente H, alquilo C_{1-8} , halógeno, OH, CF_3 , OCF_3 , OR^4 ;

Z representa $-(CH_2)_f(O)_g-$, $-CO-$ o $-CH(\text{alquilo } C_{1-8})-$;

- El anillo A representa un heterociclo saturado que contiene N de 4-7 miembros, opcionalmente sustituido con OH y en el que opcionalmente al
20 menos un N de anillo está sustituido con O;

El anillo B representa fenilo o un heterociclo insaturado que contiene N

de 4-7 miembros, opcionalmente sustituido con OH, halógeno, CN, CONH₂, CF₃, OCF₃ y en el que opcionalmente al menos un N de anillo está sustituido con O;

R² y R³ representan independientemente H, alquilo C₁₋₆ [opcionalmente sustituido con OH, halógeno, N(alquilo C₁₋₆)₂ o alquilo C₁₋₆], alquilo C₁₋₆, N(alquilo C₁₋₆)₂ o [cicloalquilo C₃₋₆];

o R² y R³, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, representan independientemente un heterociclo de 3 a 8 átomos, opcionalmente sustituido con alquilo C₁₋₆;

10 R⁴ representa alquilo C₁₋₆ lineal o ramificado,

a y c representan independientemente 0, 1 ó 2;

b, e y g representan independientemente 0 ó 1; y

d y f representan independientemente 1 ó 2.

15 2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, donde W representa NR¹.

3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o la reivindicación 2, donde R¹ representa H, alquilo C₁₋₆, -(CH₂)₆COR² o SO₂R²;

20

4. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, donde R¹ es metilo.

5. Un compuesto de acuerdo con las reivindicaciones 1 ó 2, donde R² es morfolinilo o pirimidinilo (opcionalmente sustituido con alquilo C₁₋₆)

25

374

375

[opcionalmente sustituido con OH, halógeno, N(alquilo C₁₋₆)₂, o alcoxi C₁₋₆ o NMe₂).

6. Un compuesto de acuerdo con cualquier reivindicación anterior, donde X
5 es H.

7. Un compuesto de acuerdo con cualquier reivindicación anterior, donde Y
está en la posición 4 del anillo fenileno (de acuerdo con la numeración de
fórmula (I)) a la que está unido.

10

8. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 7, donde Y es cloro.

9. Un compuesto de acuerdo con cualquier reivindicación anterior, donde el
anillo A se une al anillo B mediante un átomo de nitrógeno en el anillo A.

15

10. Un compuesto de acuerdo con cualquier reivindicación anterior, donde el
anillo A representa piperidinilo (opcionalmente sustituido con OH, y
opcionalmente al menos un N está sustituido con O).

20 11. Un compuesto de acuerdo con cualquier reivindicación anterior, donde el
anillo B representa piridinilo o pirimidinilo (opcionalmente sustituido con OH,
halógeno, CN, CONH₂, CF₃, OCF₃ y opcionalmente al menos un N de anillo
está sustituido con O).

25 12. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 11, donde el anillo B

376
376

representa piridinilo.

13. Un compuesto de acuerdo con cualquier reivindicación anterior, donde V representa -CH₂-.

5

14. Un compuesto de acuerdo con cualquier reivindicación anterior, donde Z representa -CH₂-.

15. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3,
10 donde cuando R² y R³ junto con el nitrógeno al que están unidos representan un heterociclo, el heterociclo está seleccionado entre piperazinilo, pirrolidinilo, piperidinilo, pirimidinilo, tetrahidropirranilo, o morfolinilo, opcionalmente sustituido con alquilo C₁₋₆.

15 16. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, seleccionado entre:

Triclorhidrato de 8-cloro-5-metil-1-(3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-4-il)-5,6-dihidro-4H-2,3,5,10b-tetraaza-benzo[e]azuleno;

Triclorhidrato de 8-cloro-5-isopropil-1-(3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-4-il)-5,6-dihidro-4H-2,3,5,10b-tetraaza-benzo[e]azuleno;

20 Diclorhidrato de 1-[8-cloro-1-(3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-4-il)-4H,6H-2,3,5,10b-tetraaza-benzo[e]azulen-5-il]-etanona;

8-Cloro-5-metanosulfonil-1-(3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-4-il)-5,6-dihidro-4H-2,3,5,10b-tetraaza-benzo[e]azuleno;

25 8-Cloro-5-metil-1-(1-pirimidin-2-il-piperidin-4-il)-5,6-dihidro-4H-2,3,5,10b-tetraaza-benzo[e]azuleno;

223
377

8-Cloro-5-metanosulfonil-1-(1-pirimidin-2-il-piperidin-4-il)-5,6-dihidro-4H-2,3,5,10b-tetraaza-benzo[e]azuleno;

13-Cloro-8-metil-3-(3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-4-il)-2,4,5,8-tetraaza-triciclo[9,4,0,0*2,6*]pentadeca-1(11),3,5,12,14-pentaeno;

5 13-Cloro-3-(3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-4-il)-8-oxa-2,4,5-triaza-triciclo[9,4,0,0*2,6*]pentadeca-1(11),3,5,12,14-pentaeno;

1-[8-Cloro-1-(3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-4-il)-4H,6H-2,3,5,10b-tetraaza-benzo[e]azulen-5-il]-2-dimetilamino-etanona;

10 [8-Cloro-1-(3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-4-il)-4H,6H-2,3,5,10b-tetraaza-benzo[e]azulen-5-il]-morfolin-4-il-metanona;

(+) o (-)-8-Cloro-5-(4-metil-morfolin-2-ilmetil)-1-(3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-4-il)-5,6-dihidro-4H-2,3,5,10b-tetraaza-benzo[e]azuleno;

8-Cloro-5-pirimidin-2-il-1-(3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-4-il)-5,6-dihidro-4H-2,3,5,10b-tetraaza-benzo[e]azuleno;

15 Dimetilamida del ácido 8-cloro-1-(3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-4-il)-4H,6H-2,3,5,10b-tetraaza-benzo[e]azuleno-5-sulfónico;

Dimetilamida del ácido 8-cloro-1-(1-pirimidin-2-il-piperidin-4-il)-4H,6H-2,3,5,10b-tetraaza-benzo[e]azuleno-5-sulfónico;

20 13-Cloro-9-metil-3-(3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-4-il)-2,4,5,9-tetraaza-triciclo[9,4,0,0*2,6*]pentadeca-1(11),3,5,12,14-pentaeno;

13-Cloro-8-metil-3-(1-pirimidin-2-il-piperidin-4-il)-2,4,5,8-tetraaza-triciclo[9,4,0,0*2,6*]pentadeca-1(11),3,5,12,14-pentaeno; o derivados farmacéuticamente aceptables de los mismos.

25 17. El uso de un compuesto de acuerdo con cualquiera de las

378

reivindicaciones 1 a 16 como medicamento.

18. Un procedimiento para el tratamiento de la ansiedad, enfermedad cardiovascular (incluyendo angina, aterosclerosis, hipertensión, insuficiencia
5 cardíaca, edema, hipernatremia), dismenorrea (primaria y secundaria), endometriosis, emesis (incluyendo mareos por movimiento), retardo del crecimiento intrauterino, inflamación (incluyendo artritis reumatoide), mittlemerz, preclampsia, eyaculación precoz, parto prematuro (pretérmino) o enfermedad de Raynaud, que comprende administrar una cantidad
10 terapéuticamente eficaz de un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 16 a un paciente que padece tal trastorno.

19. Un procedimiento de acuerdo con la reivindicación 18, donde el trastorno es dismenorrea (primaria o secundaria)

15

20. El uso de un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 16 en la fabricación de un medicamento para el tratamiento de la ansiedad, enfermedad cardiovascular (incluyendo angina, aterosclerosis, hipertensión, insuficiencia cardíaca, edema, hipernatremia), dismenorrea
20 (primaria y secundaria), endometriosis, emesis (incluyendo mareos por movimiento), retardo del crecimiento intrauterino, inflamación (incluyendo artritis reumatoide), mittlemerz, preclampsia, eyaculación precoz, parto prematuro (pretérmino) o enfermedad de Raynaud.

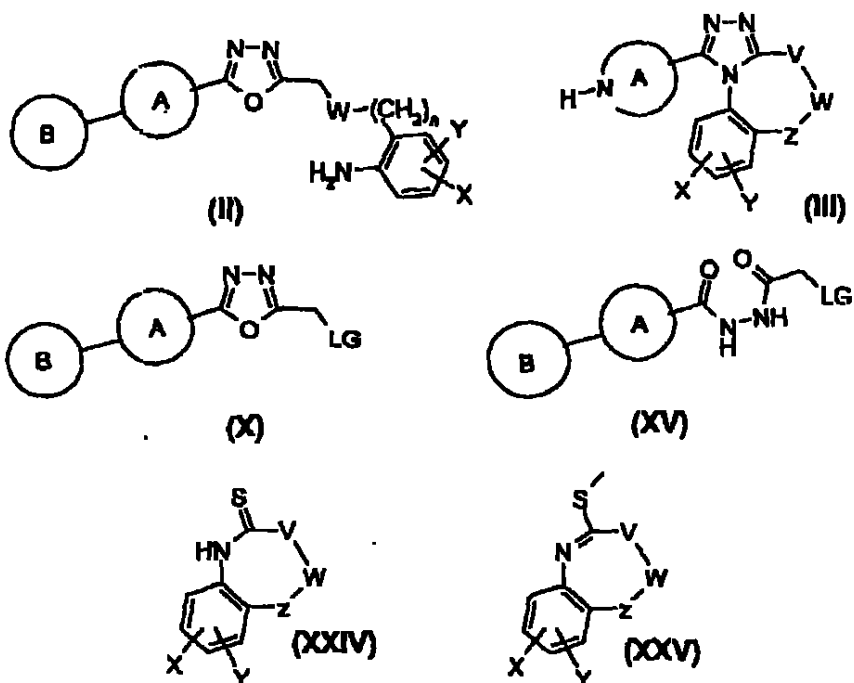
25 21. Uso de acuerdo con la reivindicación 20, para el tratamiento de

379

dismenorrea (primaria o secundaria).

22. Una formulación farmacéutica incluyendo un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 16 junto con un excipiente, diluyente o vehículo farmacéuticamente aceptable.

23. Intermedios de fórmulas (II), (III), (X), (XV), (XXIV) y (XXV):



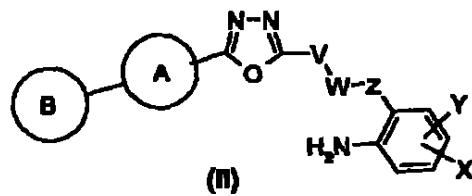
10 en las que W, X, Y, Z, anillos A y B, y n son como se han definido en la reivindicación 1 y LG representa un grupo saliente adecuado.

24. Un procedimiento para preparar un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, o un derivado farmacéuticamente aceptable del mismo,

380

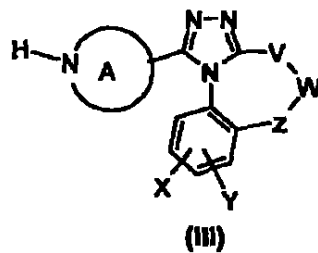
221

que comprende: hacer reaccionar un compuesto de fórmula (II) con un catalizador ácido



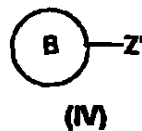
5 donde los anillos A y B y los grupos W, X, Y, y n son como se han definido anteriormente.

25. Un procedimiento para preparar un compuesto de fórmula (I) como se ha definido en la reivindicación 1, o un derivado farmacéuticamente aceptable del mismo, que comprende: hacer reaccionar un compuesto de fórmula (III)



10

con un compuesto de fórmula (IV)



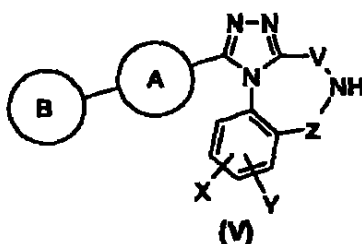
en la que los anillos A y B y los grupos W, X, Y, y n son como se han definido en la reivindicación 1, y Z' representa un grupo saliente tal como halógeno.

15

~~381~~
381

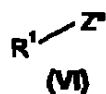
222

26. Un procedimiento para preparar un compuesto de fórmula (I) como se ha definido en la reivindicación 1, donde W representa NR^1 , o un derivado farmacéuticamente aceptable del mismo, que comprende: hacer reaccionar un compuesto de fórmula (V)



5

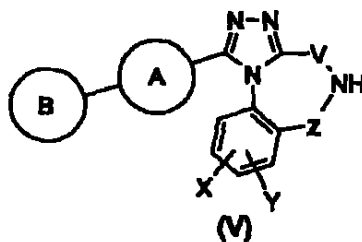
con un compuesto de fórmula (VI)



en la que los anillos A y B y los grupos R^1 , X, Y, y n son como se han definido en la reivindicación 1 y Z' representa un grupo saliente tal como halógeno.

10

27. Un procedimiento para preparar un compuesto de fórmula (I) como se ha definido en la reivindicación 1, donde W representa NR^1 , o un derivado farmacéuticamente aceptable del mismo, que comprende: hacer reaccionar un compuesto de fórmula (V)



15

con un compuesto de fórmula (VII)

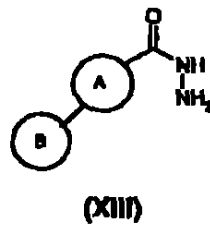
382

223

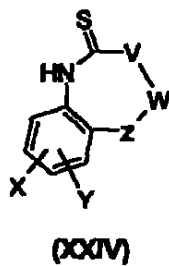


en la que los anillos A y B y los grupos R¹, X, Y, y n son como se han definido en la reivindicación 1.

- 5 28. Un procedimiento para preparar un compuesto de fórmula (I) como se ha definido en la reivindicación 1, o un derivado farmacéuticamente aceptable del mismo, que comprende: hacer reaccionar un compuesto de fórmula (XIII)



con un compuesto de fórmula (XXIV)



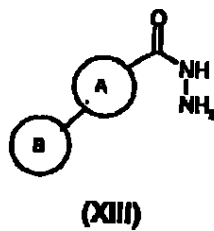
10

en la que los anillos A y B y los grupos V, W, X, Y, y Z son como se han definido en la reivindicación 1.

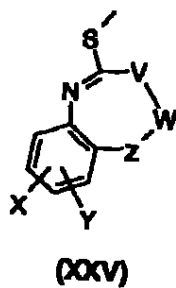
29. Un procedimiento para preparar un compuesto de fórmula (I) como se ha
15 definido en la reivindicación 1, o un derivado farmacéuticamente aceptable del mismo, que comprende: hacer reaccionar un compuesto de fórmula (XIII)

~~383~~
383

224



con un compuesto de fórmula (XXV)



en la que los anillos A y B y los grupos V, W, X, Y, y Z son como se han
5 definido en la reivindicación 1.

30. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde dicho
compuesto es dibesilato de 8-cloro-5-metil-1-(3,4,5,6-tetrahidro-2H-
[1,2']bipiridinil-4-il)-5,6-dihidro-4H-2,3,5,10b-tetraaza-benzo[e]azuleno.

10

15