

OLARTERAISBECK



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 05-101708- -00002-0000
Fec: 2006-08-01 16:53:56 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra. 11 PATENTEI/II
Cve: 379 FASCNACIONALII
Art 329 CTOINFORMACION Folios: 8

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

SOLICITUD DE:

1

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Solicitud.

2

**S LICITANTE
(71)**

Nombre: GLAXO GROUP LIMITED

Dirección: Glaxo Wellcome House, Berkely
Avenue, Greenford, Middlesex UB6 ONN.

Nacionalidad o Domicilio: BRITANICA

Lugar de Constitución: INGLATERRA

Teléfono: _____

Fax: _____

E-mail: _____

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número _____

3

**REPRESENTANTE
O APODERADO**

Nombre: J. IAN RAISBECK

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 79.376.996 Bta
TP 135.799

4

Número de expediente:

05.101.708

5

Descripción de la corrección o modificación solicitada VER PAGINA ADJUNTA

6

Comprobante de pago No. 06-54,714

Fecha Julio 18, 2006

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: J. IAN RAISBECK

FIRMA:

C.C. 79.376.996 Bta **T.P.** 135.799

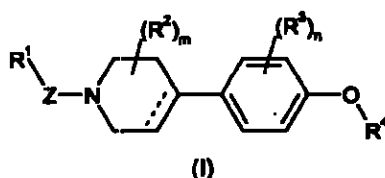
129

Modificaciones:

- En la Reivindicación 1 se limita el significado de “q” a 3 o 4. El soporte para esta modificación se encuentra en la página 6 de la descripción, líneas 15 y 16.
- La antigua Reivindicación 10 que refería compuestos específicos de la presente invención fue eliminada.
- Las antiguas Reivindicaciones 11 y 12 fueron renumeradas como nuevas Reivindicación 10 y 11.
- La **nueva Reivindicación 12** se refiere al compuesto especificado en el Ejemplo 13 (página 32 de la descripción).
- Las antiguas reivindicaciones 16 y 17 fueron eliminadas.
- Las **nuevas Reivindicaciones 16 y 18** encuentran soporte en la página 13 de la descripción, línea 11.
- La antigua Reivindicación 18 fue renumerada como nueva reivindicación 17.

CAPÍTULO REIVINDICATORIO MODIFICADO

- 5 1. Un compuesto de fórmula (I) o una de sus sales farmacéuticamente aceptables:



en la que:

R¹ representa -alquil C₁₋₆, -O-alquilo C₁₋₆, -cicloalquilo C₃₋₈, arilo, heterociclilo, heteroarilo, -alquil C₁₋₆-arilo, -alquil C₁₋₆-heteroarilo, -alquil C₁₋₆-heterociclilo, -aril-X-arilo, -aril-X-heteroarilo, -aril-X-heterociclilo, -heteroaril-X-arilo, -heteroaril-X-heteroarilo, -heteroaril-X-heterociclilo, -heterociclil-X-arilo, -heterociclil-X-heteroarilo o -heterociclil-X-heterociclilo, en la que dichos grupos alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₈, arilo, heteroarilo y heterociclilo de **R¹** pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes (por ejemplo, 1, 2 ó 3) que pueden ser los mismos o diferentes, y que se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, oxo, haloalquilo C₁₋₆, polihaloalquilo C₁₋₆, haloalcoxi C₁₋₆, polihaloalcoxi C₁₋₆, alquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, alquil C₁₋₆-tio, alcoxi C₁₋₆-alquilo C₁₋₆, cicloalquil C₃₋₇-alcoxi C₁₋₆, alcanilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆-carbonilo, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alquil C₁₋₆-sulfonil-alquilo C₁₋₆, alquil C₁₋₆-sulfonamido-alquilo C₁₋₆, alquil C₁₋₆-amido-alquilo C₁₋₆, arilsulfonilo, arilsulfonilo, ariloxi, arilsulfonamido, arilcarboxamido, arilo, o un grupo NR¹⁵R¹⁶, -CONR¹⁵R¹⁶, -NR¹⁵COR¹⁶, -NR¹⁵SO₂R¹⁶, o -SO₂NR¹⁵R¹⁶, en los que R¹⁵ y R¹⁶ representan independientemente hidrógeno o alquilo C₁₋₆ o conjuntamente forman un anillo heterocíclico;

X representa un enlace, O, CO, OCH₂, CH₂O o SO₂;

Z representa CO, CONR¹⁰ o SO₂;

R¹⁰ representa hidrógeno, alquilo C₁₋₆, -cicloalquilo C₃₋₈, arilo, heterociclilo, heteroarilo;

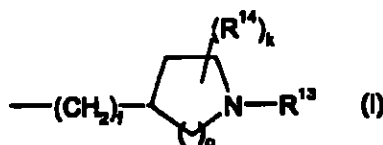
== representa un enlace simple o doble;

m y **n** representan independientemente 0, 1 ó 2;

R² representa hidrógeno, alquilo C₁₋₆ o alcoxi C₁₋₆;

R³ representa halógeno, alquilo C₁₋₆, hidroxilo, alcoxi C₁₋₆, ciano, amino, -CO-alquilo C₁₋₆, -SO₂-alquilo C₁₋₆ o trifluorometilo;

R^4 representa $-(CH_2)_q-NR^{11}R^{12}$ o un grupo de fórmula (i):



5

en la que q es 3 ó 4;

$-NR^{11}R^{12}$ representa un grupo heterocíclico (por ejemplo piperidinil o pirrolidinil) opcionalmente sustituido con uno o más (por ejemplo, 1, 2) grupos R^{17} ;

10 R^{13} representa alquilo C_{1-6} , cicloalquilo C_{3-8} , -alquil C_{1-6} -alcoxi C_{1-6} , -alquil C_{1-6} -cicloalquilo C_{3-8} ;

R^{14} y R^{17} representan independientemente halógeno, alquilo C_{1-6} , haloalquilo, OH o alcoxi C_{1-6} ;

f es 0 ó 1;

15 g es 1 ó 2;

k es 0, 1 ó 2

2. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que R^1 representa:

-arilo opcionalmente sustituido con 1 ó 2 halógenos, halo-alquilo C_{1-6} , ciano o

20 grupos SO_2Me ;

-aril-X-heterociclilo;

-heteroarilo opcionalmente sustituido con 1 ó 2 grupos haloalquilo C_{1-6} o ciano;

-heterociclilo opcionalmente sustituido con 1 ó 2 grupos oxo; o

-alquil C_{1-6} -O-alquilo C_{1-6} .

3. Un compuesto según la reivindicación 2, en el que R^1 representa tetrahidropiranilo, 4-cianofenilo, 2-cianopiridin-3-il o 2-trifluorometilpiridin-3-il.

4. Un compuesto según la reivindicación 3, en el que R^1 representa 4-cianofenilo.

30

5. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en el que X y Z representan ambos CO.

6. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en el que
35 --- representa un enlace simple.

7. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en el que m y n representan ambos 0.

8. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, en el que R^4 representa $-(CH_2)_q-NR^{11}R^{12}$, q representa 3 y $-NR^{11}R^{12}$ representa N-piperidinilo o N-pirrolidinilo opcionalmente sustituidos con 1 ó 2 grupos alquilo C_{1-6} o R^4 representa un grupo de fórmula (i) en la que f y k representan ambos 0, g representa 2 y R^{13} representa alquilo C_{1-6} o cicloalquilo C_{3-6} .
9. Un compuesto según la reivindicación 8, en el que R^4 representa un grupo de fórmula (i) en la que f y k representan ambos 0, g representa 2 y R^{13} representa un i-propilo.
10. Un compuesto según la reivindicación 1, el cual es:
5-[[4-(4-[[1-(1-Metiletil)-4-piperidinil]oxi]fenil)-1-piperidinil]carbonil]-2-piridinacarbonitrilo; o
- 15 5-[[4-(4-[[1-(1-Metiletil)-4-piperidinil]oxi]fenil)-1-piperidinil]carbonil]-2-(trifluorometil)piridina;
o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.
11. Un compuesto según la reivindicación 1, el cual es:
20 4-[[4-(4-[[1-(1-Metiletil)-4-piperidinil]oxi]fenil)-1-piperidinil]carbonil]benzonitrilo,
o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.
12. Un compuesto según la reivindicación 1, el cual es:
1-(1-Metiletil)-4-[[4-(1-[[4-(1-pirrolidinilcarbonil)fenil]carbonil]-4-piperidinil) fenil]oxi]piperidina;
5 o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.
13. Una composición farmacéutica, que comprende el compuesto de fórmula (I) según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12, o una de sus sales farmacéuticamente aceptables y un vehículo o excipiente farmacéuticamente aceptable.
- 30 14. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12 o una de sus sales farmacéuticamente aceptables para usar en terapia.
- 35 15. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12 o una de sus sales farmacéuticamente aceptables para usar en el tratamiento de enfermedades neurológicas.

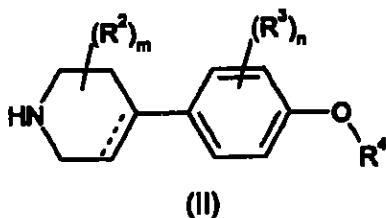
16. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12 o una de sus sales farmacéuticamente aceptables para usar en el tratamiento de la rinitis alérgica.

17. Una composición farmacéutica para uso en el tratamiento de enfermedades neurológicas, que comprende el compuesto de fórmula (I) según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12, o una de sus sales farmacéuticamente aceptables, y un vehículo o excipiente farmacéuticamente aceptable.

18. Una composición farmacéutica para uso en el tratamiento de la rinitis alérgica, que comprende el compuesto de fórmula (I) según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12, o una de sus sales farmacéuticamente aceptables, y un vehículo o excipiente farmacéuticamente aceptable.

19. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula (I) o de una de sus sales farmacéuticamente aceptables, procedimiento que comprende:

(a) preparar un compuesto de fórmula (I) en la que Z representa CO, que comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula (II)



o uno de sus derivados opcionalmente activado o protegido, en la que --- , R^2 , R^3 , R^4 , m y n son como se definieron en la reivindicación 1, con un compuesto de fórmula $R^1\text{-CO-L}^1$, en la que R^1 es como se definió en la reivindicación 1 y L^1 representa un grupo saliente adecuado tal como un átomo de halógeno adecuado, o un grupo hidroxilo; o

(b) preparar un compuesto de fórmula (I) en la que Z representa SO_2 , que comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula (II) con un compuesto de fórmula $R^1\text{-SO}_2\text{-L}^2$, en la que R^1 es como se definió en la reivindicación 1, y L^2 representa un grupo saliente adecuado, tal como un átomo de halógeno adecuado (por ejemplo, cloro); o

(c) preparar un compuesto de fórmula (I) en la que Z representa CONH, que comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula (II) con un compuesto de

fórmula $R^1-N=C=O$, en la que R^1 es como se definió en la reivindicación 1; o

(d) preparar un compuesto de fórmula (I) en la que Z representa $CONR^{10}$, que comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula (II) con un compuesto de
5 fórmula $R^1R^{10}N-L^3$, en la que R^1 y R^{10} son como se definieron en la reivindicación 1, y L^3 representa hidrógeno o $COCl$; o

(e) desproteger un compuesto de fórmula (I) o convertir los grupos que están protegidos; y de aquí en adelante opcionalmente

(f) interconversión en otros compuestos de fórmula (I).

135
8

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 05-101708- -00002-0000
Fec: 2006-08-01 16:53:56 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra. 11 PATENTEIYII
Cve: 379 FASENACIONALII
Art 329 CTOINFORMACION Folios: 8

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 06 - 54,714
FECHA : JULIO 18 DE 2006

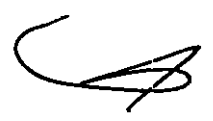
***** C O N S I G N A C I O N *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
OLARTE RAISDEGR	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	52202900	18/07/2006	3,092,000.00

***** 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
			95,000.00
		TOTAL :	95,000.00

SON: NOVENTA Y CINCO MIL PESOS



RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____