

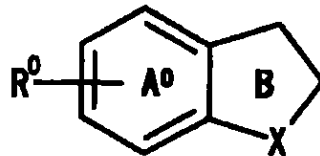
FORMULARIO UNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES
2000-F03

1	SOLICITUD DE: ☐ Corrección de Error Material ☒ Modificación a una solicitud	
2 SOLICITANTE	Nombre: TAKEDA PHARMACEUTICAL COMPANY LIMITED Dirección: 1-1, Doshomachi 4-chome, Chuō-ku, Osaka-shi, Osaka Japón Domicilio: Osaka Japón Lugar de Constitución: Japón Teléfono: 546 09 70 Fax: 547 31 70 E-mail: clientes@camyp.com	IDENTIFICACION C.C. ☐ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Número: _____
3 REPRESENTANTE O APODERADO	Nombre: Emilio FERRERO Dirección: Carrera 4ª No. 72-35 Teléfono: 347 36 11 Fax: 211 86 50 E-mail: cavelier@cavelier.com	IDENTIFICACION C.C. ☒ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Número: 438.019 TP 31.929
4 Número de expediente: 05129098		
5 Descripción de la corrección o modificación solicitada: Presento nuevo capítulo reivindicatorio compuesto por 36 reivindicaciones. Por lo tanto, solicito que se realice el examen de patentabilidad sobre este nuevo capítulo reivindicatorio.		
6 Comprobante de pago		
7 Anexos		
8 NOMBRE: EMILIO FERRERO FIRMA:  C.C. 438.019 de Usaquén T.P.A. 31.929		

Reivindicaciones:

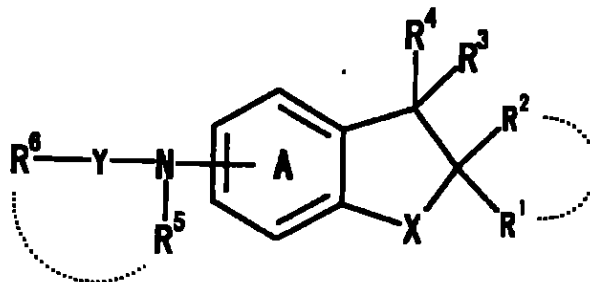
Habiéndose descrito la invención como antecede, se reclama como propiedad lo contenido en las siguientes reivindicaciones.

- 5 1. Un modulador del receptor canabinoide, caracterizado porque contiene un compuesto representado por la fórmula (I₀)

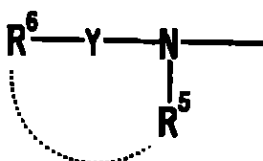


- 10 en donde, X es un átomo de oxígeno, un átomo de azufre opcionalmente substituido o un grupo imino opcionalmente substituido, R⁰ es un grupo acilamino opcionalmente substituido, el anillo A⁰ es un anillo de benceno el cual puede además tener un substituyente además de R⁰, y el anillo
- 15 B es un heterociclo de 5 miembros opcionalmente substituido, o una sal del mismo o un profármaco del mismo.

2. El modulador de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque el compuesto representado por la Fórmula (I₀) o una sal del mismo o un profármaco del mismo es un
- 20 compuesto representado por la fórmula (I)



en donde, X es un átomo de oxígeno, un átomo de azufre
 opcionalmente substituido o un grupo imino opcionalmente
 substituido, R¹, R², R³ y R⁴ son independientemente un átomo
 de hidrógeno, un grupo hidrocarburo opcionalmente
 5 substituido, un grupo heterocíclico opcionalmente
 substituido, un grupo hidroxilo opcionalmente substituido,
 un grupo mercapto opcionalmente substituido o un grupo
 amino opcionalmente substituido, o R² y R³ pueden tomarse
 juntos para formar un enlace, o R¹ y R² pueden tomarse con
 10 el átomo de carbono adyacente para formar un anillo
 opcionalmente substituido, Y es -CO-, -SO-, ó -SO₂-, R⁵ es
 un átomo de hidrógeno o un grupo hidrocarburo opcionalmente
 substituido, R⁶ es un átomo de hidrógeno, un grupo
 hidrocarburo opcionalmente substituido, un grupo hidroxilo
 15 opcionalmente substituido o un grupo amino opcionalmente
 substituido, o R⁵ y R⁶ pueden tomarse con el átomo de
 carbono o átomo de azufre adyacente y átomo de nitrógeno
 para formar un anillo opcionalmente substituido, y el
 anillo A es un anillo de benceno el cual puede además tener
 20 un substituyente además de un grupo representado por la
 siguiente fórmula



en donde, cada uno de los símbolos tiene el mismo significado como se describe arriba, o una sal del mismo o un profármaco del mismo.

3. El modulador de conformidad con la reivindicación 2,
5 caracterizado porque R^1 y R^2 son un átomo de hidrógeno.

4. El modulador de conformidad con la reivindicación 2, caracterizado porque R^1 y R^2 son respectivamente un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C_{1-4} , con la condición de que R^1 y R^2 no son un átomo de hidrógeno al mismo tiempo.

10 5. El modulador de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque el compuesto representado por la fórmula (I_0) o la sal del mismo es un agonista del receptor canabinoide.

6. El modulador de conformidad con la reivindicación 5,
15 caracterizado porque el receptor canabinoide es receptor canabinoide de tipo 1.

7. El modulador de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque el compuesto representado por la fórmula (I_0) o la sal del mismo es un antagonista del receptor
20 canabinoide.

8. El modulador de conformidad con la reivindicación 7, caracterizado porque el receptor canabinoide es receptor canabinoide de tipo 1.

9. El modulador de conformidad con la reivindicación 1,
25 caracterizado porque el compuesto representado por la fórmula

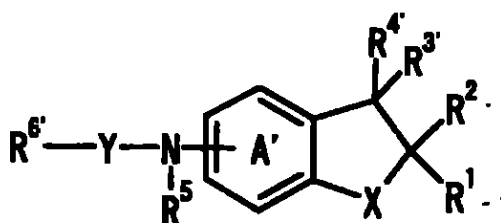
(I₀) o una sal del mismo es un agonista del receptor canabinoide de tipo 2.

10. El modulador de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque es un agente para prevenir, tratar o
5 aliviar dolor agudo, trastornos cerebrovasculares, daño en la medula espinal, lesión en la cabeza, esclerosis múltiple, glaucoma, depresión, vómito, artritis, o asma.

11. El modulador de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque es un agente para prevenir o tratar
10 trastornos de la memoria, enfermedades psiquiátricas, obesidad, enfermedades mentales, ansiedad, depresión, fármaco dependencia, Alzheimer, demencia o enfermedad de Parkinson, o una ayuda para dejar de fumar.

12. El modulador de conformidad con la reivindicación 1,
15 caracterizado porque es un agente para prevenir o tratar esclerosis múltiple, enfermedades neurodegenerativas, síndrome de intestino irritable, enfermedad de Crohn, oesofagitis de reflujo, COPD, psoriasis, enfermedades autoinmunes, rechazo al injerto, enfermedades alérgicas, dolor psicogénico, virus de
20 hepatitis o hipertensión, o un agente de inmunidad regulada.

13. Un compuesto representado por la fórmula (I')



caracterizado porque, X es un átomo de oxígeno, un átomo de azufre opcionalmente substituido o un grupo imino opcionalmente substituido, R^1 y R^2 son independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo hidrocarburo opcionalmente substituido, un grupo heterocíclico opcionalmente substituido, un grupo hidroxilo opcionalmente substituido, un grupo mercapto opcionalmente substituido o un grupo amino opcionalmente substituido, o R^1 y R^2 pueden tomarse con el átomo de carbono adyacente para formar un anillo opcionalmente substituido, $R^{3'}$ es un átomo de hidrógeno, un grupo hidrocarburo opcionalmente substituido, un grupo hidroxilo opcionalmente substituido, un grupo mercapto opcionalmente substituido o un grupo amino opcionalmente substituido, $R^{4'}$ es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo opcionalmente substituido, un grupo arilo opcionalmente substituido, o un grupo heterocíclico opcionalmente substituido, Y es -CO-, -SO-, ó -SO₂-, R^5 es un átomo de hidrógeno o un grupo hidrocarburo opcionalmente substituido, $R^{6'}$ es un grupo hidrocarburo opcionalmente substituido (con la condición de que ambos de R^1 y R^2 no son un átomo de hidrógeno, $R^{6'}$ no es un anillo de benceno), un grupo hidroxilo opcionalmente substituido o un grupo amino opcionalmente substituido, y el anillo A' es un anillo de benceno el cual puede además tener un substituyente en adición a un grupo representado por la siguiente fórmula



en donde, cada uno de los símbolos tiene el mismo
5 significado como se describe arriba,
o una sal del mismo.

14. El compuesto de conformidad con la reivindicación
13, caracterizado porque R^1 y R^2 son independientemente un
átomo de hidrógeno, un grupo hidrocarburo opcionalmente
10 substituido, un grupo heterocíclico opcionalmente
substituido, un grupo hidroxilo opcionalmente substituido, un
grupo mercapto opcionalmente substituido o un grupo amino
opcionalmente substituido.

15. El compuesto de conformidad con la reivindicación
15 13, caracterizado porque R^1 y R^2 son un átomo de hidrógeno.

16. El compuesto de conformidad con la reivindicación
13, caracterizado porque R^1 y R^2 son respectivamente un átomo
de hidrógeno o un grupo alquilo C_{1-4} , con la condición de que
 R^1 y R^2 no son un átomo de hidrógeno al mismo tiempo.

20 17. El compuesto de conformidad con la reivindicación
13, caracterizado porque R^3 es un átomo de hidrógeno.

18. El compuesto de conformidad con la reivindicación
13, caracterizado porque R^4 es un grupo arilo C_6-14
opcionalmente substituido o un grupo heterocíclico de 5 a 14
25 miembros opcionalmente substituido.

19. El compuesto de conformidad con la reivindicación 13, caracterizado porque $R^{4'}$ es un grupo fenilo opcionalmente substituido.

20. El compuesto de conformidad con la reivindicación 19, caracterizado porque $R^{4'}$ es un grupo fenilo el cual puede ser substituido con un grupo alquilo C_{1-4} opcionalmente substituido o un grupo alcoxi C_{1-4} opcionalmente substituido,

21. El compuesto de conformidad con la reivindicación 13, caracterizado porque Y es -CO-.

22. El compuesto de conformidad con la reivindicación 13, caracterizado porque R^5 es un átomo de hidrógeno.

23. El compuesto de conformidad con la reivindicación 13, caracterizado porque X es un átomo de oxígeno.

24. El compuesto de conformidad con la reivindicación 13, caracterizado porque la posición 5 del heterociclo fusionado en la fórmula (I') está substituida por un grupo representado por la siguiente fórmula



20

en donde, cada uno de los símbolos tiene el mismo significado como se describe arriba.

25. El compuesto de conformidad con la reivindicación 24, caracterizado porque la posición 7 del heterociclo fusionado en la fórmula (I') está además substituida por un

grupo arilo C₆₋₁₄-alquilo C₁₋₄ opcionalmente sustituido.

26. El compuesto como se describe de conformidad con la reivindicación 25, caracterizado porque el grupo arilo C₆₋₁₄-alquilo C₁₋₄ opcionalmente sustituido es un grupo bencilo
5 opcionalmente sustituido.

27. El compuesto de conformidad con la reivindicación 13, caracterizado porque el anillo A' es un anillo de benceno el cual puede además tener 1 a 3 substituyentes seleccionados de un grupo alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido, un grupo
10 arilo C₆₋₁₂ opcionalmente sustituido, un grupo heterocíclico de 5 ó 6 miembros opcionalmente sustituido y un grupo acilo además de un grupo representado por la siguiente fórmula



15

en donde, cada uno de los símbolos tiene el mismo significado como se describe arriba.

28. El compuesto de conformidad con la reivindicación 27, caracterizado porque la posición 7 del heterociclo fusionado en la fórmula (I₀) es sustituido por un grupo
20 alquilo C₁₋₄ opcionalmente sustituido, un grupo arilo C₆₋₁₂ opcionalmente sustituido, un grupo heterocíclico de 5 ó 6 miembros opcionalmente sustituido, o un grupo acilo.

29. El compuesto de conformidad con la reivindicación
25 27, caracterizado porque la posición 7 del heterociclo

fusionado en la fórmula (I₀) está substituida por un grupo fenilo, un grupo furanilo, un grupo tienilo, un grupo piridilo, un grupo acetilo, un grupo propionilo, un grupo butirilo, o un grupo benzoilo, los cuales pueden ser substituidos, respectivamente.

30. N-(3-(4-isopropilfenil)-4,6,7-trimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida,

(+)-N-((3R)-3-(4-isopropilfenil)-4,6,7-trimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida,

10 N-(7-acetil-3-(4-isopropilfenil)-4,6-dimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida,

N-(3-(4-isopropilfenil)-7-metoxi-4,6-dimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida,

15 (+)-N-((3R)-7-acetil-3-(4-isopropilfenil)-4,6-dimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida,

(+)-N-(tert-butil)-N'-((3R)-3-(4-isopropilfenil)-4,6,7-trimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)urea,

N-(3-(4-isopropilfenil)-4,6-dimetil-7-fenil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida,

20 N-(7-(3-dimetilaminofenil)-3-(4-isopropilfenil)-4,6-dimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida,

N-(3-hidroxipropil)-N'-(3-(4-isopropilfenil)-4,6,7-trimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)urea,

25 N-((4-isopropil-3-(2-metoxietoxi)-4-isopropilfenil)-4,6,7-trimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il))-3,3-

dimetilbutanamida,

N-(7-(4-isopropilbencil)-3,4,6-trimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida,

N-(3-(4-tert-butilfenil)-2,2,4,6,7-pentametil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida, o

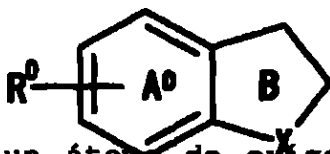
N-(3-(4-isopropilfenil)-4,6,7-trimetil-3H-espiro(1-benzofuran-2,1'-ciclopentan)-5-il)-3,3-dimetilbutanamida,

31. Un profármaco del compuesto de conformidad con la reivindicación 13.

32. Un fármaco, caracterizado porque comprende el compuesto como se describe de conformidad con la reivindicación 13, o un profármaco del mismo.

33. El compuesto representado por la fórmula (I₀)

15

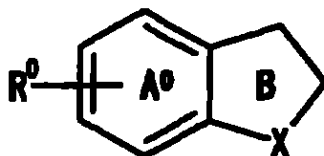


en donde, X es un átomo de oxígeno, un átomo de azufre opcionalmente substituido o un grupo imino opcionalmente substituido, R⁰ es un grupo acilamino, el anillo A⁰ es un anillo de benceno el cual puede además tener un substituyente además de R⁰, y el anillo B es un heterociclo de 5 miembros opcionalmente substituido, o una sal del mismo o un profármaco del mismo, útil para la manufactura de un agente para prevenir o tratar enfermedades cerebrovasculares agudas, daño en la medula espinal, lesión en la cabeza, esclerosis

múltiple, glaucoma, depresión, vómito, artritis, o asma; o para la manufactura de un agente analgésico.

34. El compuesto representado por la fórmula (I₀)

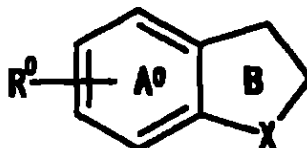
5



en donde, X es un átomo de oxígeno, un átomo de azufre opcionalmente substituido o un grupo imino opcionalmente substituido, R⁰ es un grupo acilamino, el
 10 anillo A⁰ es un anillo de benceno el cual puede además tener un substituyente además de R⁰, y el anillo B es un heterociclo de 5 miembros opcionalmente substituido, o una sal del mismo o un profármaco del mismo, útil para la manufactura de un agente para prevenir o tratar
 15 trastornos de la memoria, enfermedades psiquiátricas, obesidad, enfermedades mentales, ansiedad, depresión, farmacodependencia, Alzheimer, demencia o enfermedad de Parkinson, o una ayuda para dejar de fumar.

35. El compuesto representado por la fórmula (I₀)

20

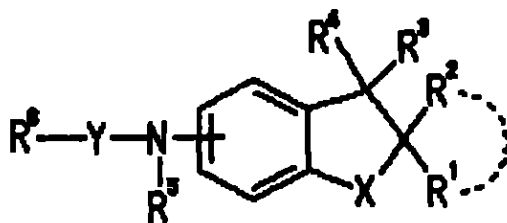


en donde, X es un átomo de oxígeno, un átomo de azufre
 25 opcionalmente substituido o un grupo imino opcionalmente

substituido, R^0 es un grupo acilamino, el anillo A^0 es un anillo de benceno el cual puede además tener un substituyente además de R^0 , y el anillo B es un heterociclo de 5 miembros opcionalmente substituido, o una sal del mismo o un profármaco del mismo, útil para la manufactura de un agente para prevenir o tratar esclerosis múltiple, enfermedades neurodegenerativas, síndrome de intestino irritable, enfermedad de Crohn, oesofagitis de reflujo, COPD, psoriasis, enfermedades autoinmunes, rechazo al injerto, enfermedades alérgicas, dolor psicogénico, virus de hepatitis o hipertensión, o un agente de inmunidad regulada.

36. Un método para preparar un compuesto representado por la siguiente fórmula

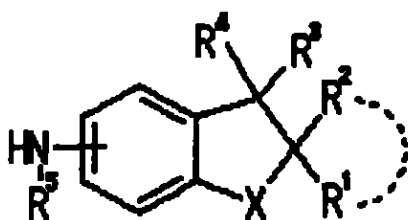
15



20

en donde, cada uno de los símbolos tiene el mismo significado como se describe a continuación, o una sal del mismo, caracterizado porque comprende hacer reaccionar un compuesto representado por la siguiente fórmula

25



5

en donde, X es un átomo de oxígeno, un átomo de azufre opcionalmente substituido o un grupo imino opcionalmente substituido,

R¹, R², R³ y R⁴ son independientemente un átomo de
 10 hidrógeno, un grupo hidrocarburo opcionalmente substituido, un grupo heterocíclico opcionalmente substituido, un grupo hidroxilo opcionalmente substituido, un grupo mercapto opcionalmente substituido o un grupo amino opcionalmente substituido, o R² y R³ pueden tomarse juntos para formar un
 15 enlace, o R¹ y R² pueden tomarse con el átomo de carbono adyacente para formar un anillo opcionalmente substituido,

R⁵ es un átomo de hidrógeno o un grupo hidrocarburo opcionalmente substituido, R⁶ es un átomo de hidrógeno, un grupo hidrocarburo opcionalmente substituido, un grupo
 20 hidroxilo opcionalmente substituido o un grupo amino opcionalmente substituido, o R⁵ y R⁶ pueden tomarse junto con el átomo de carbono adyacente o átomo de azufre y átomo de nitrógeno para formar un anillo opcionalmente substituido, y

el anillo A es un anillo de benceno el cual tiene además
 25 un substituyente además de un grupo representado por la

fórmula -NHR_5 (en donde, cada uno de los símbolos tiene el mismo significado como se describe arriba), o una sal del mismo con,

R^6YL , $(\text{R}^6\text{Y})_2\text{O}$ ó $\text{R}^6\text{N}=\text{Y}$, en donde, L es un grupo de 5 partida, e Y es -CO- , -SO- , ó $\text{-SO}_2\text{-}$.

1381

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rég. 05-128088-00001-0000
FOLIO 200-12-28 1833002 Dep. 2000 NUEVECENTOS
LIB. 11 PATENTE DE
LIT. 340 FASE NACIONAL
ACT 350 CUMPLIMIENTO FOLIO 10

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 06 - 96,783
FECHA : DICIEMBRE 19 DE 2006

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	55272328	19/12/2006	34,033,600.00

***** CONCEPTO *****

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	21 CERTIFICACIONES	10,500.00
TOTAL :		10,500.00

SON: DIEZ MIL QUINIENTOS PESOS



RESPONSABLE : _____ COLO 14656 841 006 3

1382

SUPLENIENTE EN LA LEY DE PATENTES Y COMERCIO
 Nro. 05-128086-00001-0000
 Pto. 2005-12-20 18:30:02 Imp. 2005 00:00:00
 Pg. 11 PATENTE
 EYE: 3/0 PATENTE
 - 05-128086-00001-0000 - Follow: 114

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 000174099-2

RECIBO OFICIAL DE CAVA : 06 - 96,782
FECHA : DICIEMBRE 19 DE 2006

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	55272328	19/12/2004	34,033,600.

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

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	
		21 CERTIFICACIONES	10,500.00
		TOTAL :	\$ 10,500.00

SUM: DIEZ MIL CINCUENTOS PESOS

RESPONSABLE : _____

COL 14656 841 006 3

1383

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NOC: 05-128088-00001-0000
FOE: 2008-12-28 10:22:02 Usp. 2008 NUEVECEINTOS Y OCHO
108 11 PATENTE
EMP: 310 HABENACULALIA
AD: 300 CUMPLIMIENTO Folio: 10

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 06 - 96,781
FECHA : DICIEMBRE 19 DE 2006

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	55272328	19/12/2006	34,033,600.

***** CONCEPTO *****

CANT. CONTABILISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	21 CERTIFICACIONES	10,500.00
TOTAL :		\$ 10,500.00

SOM: DIEZ MIL QUINIENTOS PESOS

RESPONSABLE :  COLO 14656 841 006 3

1384

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT: 05-128098-00001-0000
P.O. 2005-12-28 10:30:00 Dep. 2005-12-28
TEL. 11 PATENTE
EPO: 3/0 FARMACIA
AC: 2005-12-28 10:30:00

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 860176087-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 06 - 96,796
FECHA : DICIEMBRE 19 DE 2006

***** CONSIGNACION *****

DEBITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	55272328	19/12/2006	34,033,600.

***** CONCEPTO *****

CANT. HISTORICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 30005-01-01 SOLICITUDES	83 INVOCACION DE UNA PRIORIDAD EN SI	65,000.00
	TOTAL :	65,000.00

SON: SESENTA Y CINCO MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

CCO 14656 841 006 3