



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
 Rad: 06-094724- -00001-0000
 Fee: 2006-12-29 15:42:50 Dep. 2020 NUECREACIONES
 Trá 11 PATENTE Y
 Eje: 379 FASE NACIONAL II
 Ant 209 CTI INFORMACION FOLIO 18

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

SOLICITUD DE:

1

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Solicitud.

2

S LICITANTE
(71)

Nombre: PFIZER INC

Dirección: 235 East 42nd Street, New York, NY 10017 E.U.A

Nacionalidad o Domicilio: ESTADOUNIDENSE

Lugar de Constitución: Estados Unidos de America.

Teléfono: 601-7700

Fax: 601-7799

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. 8A - 37 Piso 10, Bogotá.

Teléfono: _____ Fax: _____

E-mail: _____

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número 79.792.474 Bta.
TP 74.295

4

Número de expediente:

06-094.724

5

Descripción de la corrección o modificación solicitada Se eliminaron las reivindicaciones 16 y 17.

6

Comprobante de pago No. 06-93.133

Fecha Diciembre 5, 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: CARLOS R. OLARTE

FIRMA: _____

C.C. 79.782.747 Bta T.P. 74.295.

927

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 06-094724- 00001-0000
Fe: 2006-12-29 18:42:50 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra. 11 PATENTE/VI
Eve: 379 FASENACIONALI
Act: 329 CTOINFORMACION Folio: 18

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 06 - 93,133
FECHA : DICIEMBRE 5 DE 2006

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
OLARTE RAISBERG	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	52198877	04/12/2006	3,956,000.00

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

ANT. HISTORICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-03 CAMBIO DE NODALIDAD Y MODIFICA	12 MARCAS Y LEHAS COMERCIALES	95,000.00
	TOTAL :	95,000.00

CON: NOVENTA Y CINCO MIL PESOS

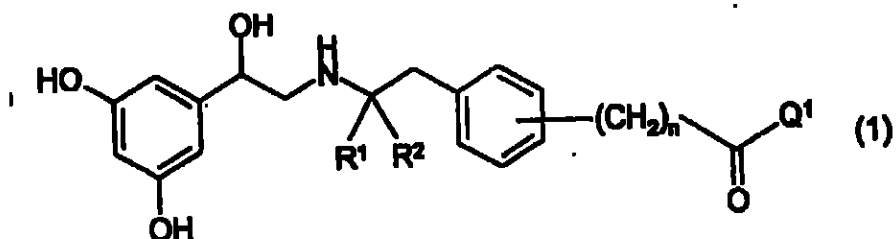
RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

CAPÍTULO REIVINDICATORIO MODIFICADO

928 /

1. Un compuesto de fórmula general (1):

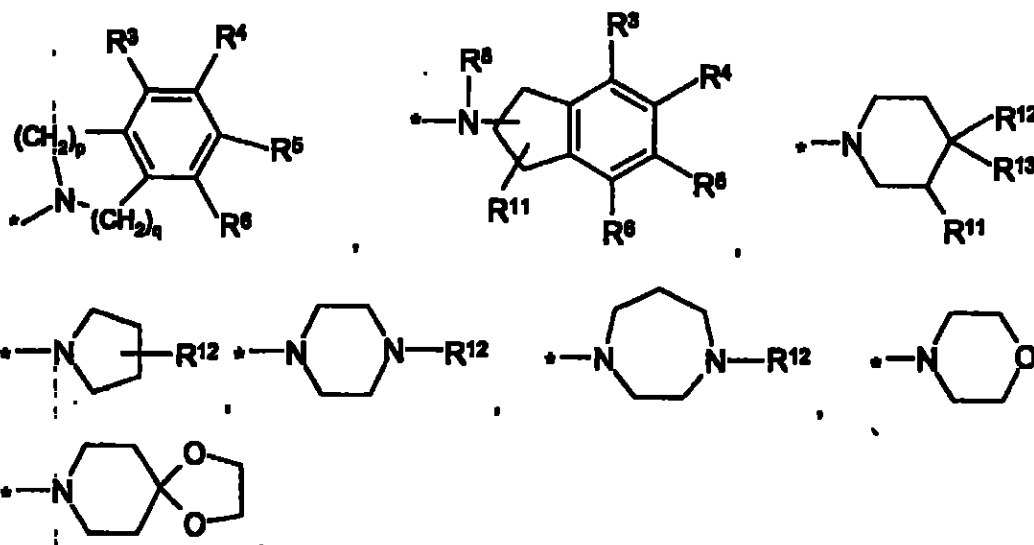


en la que el grupo $(CH_2)_n-C(=O)Q^1$ está en la posición meta o para,

- R^1 y R^2 se seleccionan independientemente entre H y alquilo C_1-C_4 ,

-n es 0, 1 ó 2 y

- Q^1 es un grupo seleccionado entre,



*- NR^8-Q^2-A o *- NR^8-Q^3 , donde

-p es 1 ó 2 y g es 1 ó 2,

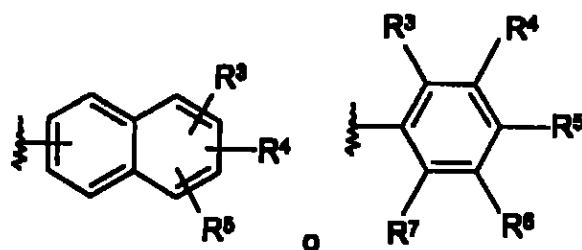
- Q^2 es un enlace sencillo o un alquileo C_1-C_4 opcionalmente sustituido con OH,

- R^8 es H ó alquilo C_1-C_4 y,

- Q^3 es alquilo C_1-C_6 opcionalmente sustituido con NR^9R^{10} , OR^9 o fenoxi,

-A se selecciona entre:

- cicloalquilo C_3-C_{10} , estando dicho cicloalquilo opcionalmente unido con uno o más, preferiblemente 1, 2, 3 ó 4, átomos de carbono, y estando opcionalmente sustituido con un grupo hidroxilo,
- un grupo heterocíclico de 5 a 6 miembros, opcionalmente aromático, que contiene uno o dos heteroátomos seleccionados entre O, N o S, opcionalmente sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados entre alquilo C_1-C_4 , bencilo y ciclopropilmetilo o
- un grupo



quinolilo o isoquinolilo.

- R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y R^7 son iguales o diferentes y se seleccionan entre H, alquilo C_1-C_4 , OR^9 , SR^9 , SOR^9 , SO_2R^9 , halo, CN, CF_3 , OCF_3 , $SO_2NR^9R^{10}$, $COOR^9$, $CONR^9R^{10}$, NR^9R^{10} , $NHCOR^{10}$ y fenilo opcionalmente sustituido con OH;

- R^9 y R^{10} son iguales o diferentes y se seleccionan entre H o alquilo C_1-C_4 ,

- R^{11} se selecciona entre H o OH, y,

- R^{12} y R^{13} son iguales o diferentes y se seleccionan entre H, alquilo C_1-C_4 opcionalmente sustituido con OR^9 , OR^9 , $C(=O)NH_2$, $C(=O)CH_3$, $N(CH_3)C(=O)CH_3$, $C(=O)OR^9$, fenilo opcionalmente sustituido con halógeno, piridilo opcionalmente sustituido con CN, oxadiazolilo opcionalmente sustituido con alquilo C_1-C_4 , y,

- * representa el punto de unión al grupo carbonilo;

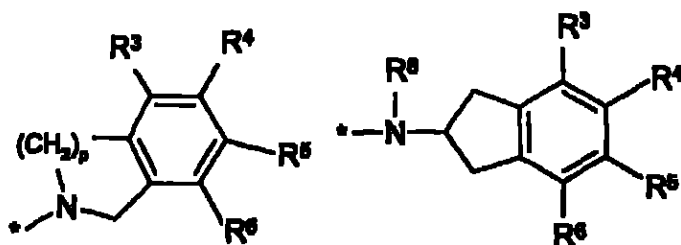
o, si es apropiado, sus sales farmacéuticamente aceptables y/o isómeros, tautómeros, solvatos o variaciones isotópicas del mismo.

2. Un compuesto de fórmula general (1) de acuerdo con la reivindicación 1, en el que el grupo $(CH_2)_n-C(=O)Q^1$ está en la posición meta o para,

- R^1 y R^2 se seleccionan independientemente entre H y alquilo C_1-C_4 ,

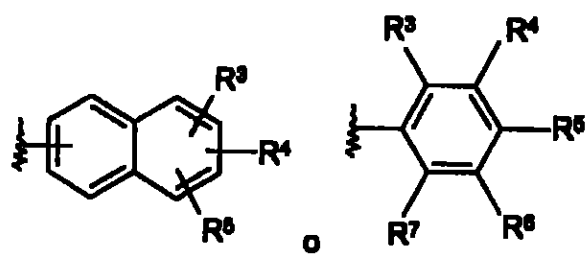
- n es 0, 1 ó 2 y

- Q^1 es un grupo seleccionado entre,



y un grupo $*-NR^8-Q^2-A$, donde p es 1 ó 2, Q^2 es un alquileno C_1-C_4 , R^8 es H o alquilo C_1-C_4 y A es piridilo, cicloalquilo C_3-C_{10} , estando dicho cicloalquilo opcionalmente unido con 1, 2, 3 ó 4 átomos de carbono, tetrahidropirano, piperidinilo, tetrahidrotiopirano o un grupo

430 4



- R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y R^7 son iguales o diferentes y se seleccionan entre H, alquilo C_1 - C_4 , OR^9 , SR^9 , SOR^9 , SO_2R^9 , halo, CN, CF_3 , OCF_3 , $SO_2NR^9R^{10}$, $COOR^9$, $CONR^9R^{10}$, NR^9R^{10} , $NHCOR^{10}$ y fenilo opcionalmente sustituido con OH,

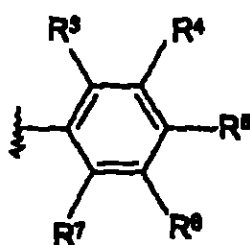
- R^9 y R^{10} son iguales o diferentes y se seleccionan entre H o alquilo C_1 - C_4 y * representa el punto de unión al grupo carbonilo;

o, si es apropiado, sus sales farmacéuticamente aceptables y/o isómeros, tautómeros, solvatos o variaciones isotópicas del mismo.

3. A compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2, en el que Q^1 es un grupo *-NH- Q^2 -A, donde A es ciclohexilo o adamantilo.

4. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2 en el que A es naftilo opcionalmente sustituido con OR^9 .

5. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 2, en el que Q^1 es un grupo *-NH- Q^2 -A, donde A es un grupo



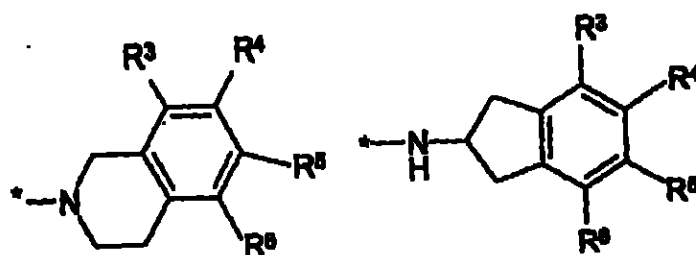
donde R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y R^7 son iguales o diferentes y se seleccionan entre H, alquilo C_1 - C_4 , OR^9 , SR^9 , halo, CN, CF_3 , OCF_3 , $SO_2NR^9R^{10}$, $COOR^9$, $CONR^9R^{10}$, NR^9R^{10} , $NHCOR^{10}$ y fenilo opcionalmente sustituido con OH, con la condición de que al menos 2 de R^3 a R^7 sean H;

donde R^9 y R^{10} son iguales o diferentes y se seleccionan entre H o alquilo C_1 - C_4 .

6. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 5 en el que Q^2 es - CH_2 -, - $(CH_2)_2$ -, - $(CH_2)_3$ -, - $CH(CH_3)$ -, - $CH_2CH(CH_3)$ - o $C(CH_3)_2$ -.

7. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2 en el que Q^1 es

431/6



donde R_3, R_4, R_5 y R_6 son H.

8. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7 en el que R^1 es H o CH_3 y R^2 es CH_3 .

9. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 en el que n es 0 ó 1.

10. El estereoisómero (R,R) de un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9.

11. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10 en el que el grupo $(CH_2)_n-C(=O)Q^1$ está en la posición meta.

12. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 seleccionado entre el grupo que consiste en:

N-bencil-2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]acetamida;

N-ciclopropil-2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]acetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-*N*-[(1*R*,2*S*)-2-(hidroximetil)ciclohexil]acetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-*N*-(3-morfolin-4-ilpropil)acetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-*N*-(piridin-2-ilmetil)acetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-*N*-(2-morfolin-4-iletil)acetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-*N*-isopropilacetamida;

N-(4-clorobencil)-2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-

327

metilpropil)fenil]acetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-N-[2-(dimetilamino)etyl]acetamida;

N-[2-(dietilamino)etyl]-2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]acetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-N-[3-(dimetilamino)propil]acetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-N-pentilacetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-N-(2-pirrolidin-1-iletal)acetamida;

N-(2,4-diclorobencil)-2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]acetamida;

N-(3,4-diclorobencil)-2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]acetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-N-(4-metoxibencil)acetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-N-(2-hidroxietyl)acetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-N-propilacetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-(metilpropil)fenil]-N-(3-metoxipropil)acetamida;

N-ciclobutil-2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]acetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-N-[(1R)-1-(1-naftil)etyl]acetamida;

N-2,3-dihidro-1H-inden-1-il-2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]acetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-N-[2-(1-metilpirrolidin-2-il)etyl]acetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-(metilpropil)fenil]-N-(4-fluorobencil)acetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-N-(4-fenilbutil)acetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-N-(3-metoxibencil)acetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-N-(3-

33 8

etoxipropil)acetamida;

2-[3-(2-([2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino)-2-metilpropil)fenil]-N-(3,4,5-trimetoxibencil)acetamida;

2-[3-(2-([2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino)-2-metilpropil)fenil]-N-[4-(trifluorometil)bencil]acetamida;

2-[3-(2-([2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino)-2-metilpropil)fenil]-N-[2-(trifluorometil)bencil]acetamida;

2-[3-(2-([2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino)-2-metilpropil)fenil]-N-(3,5-dimetoxibencil)acetamida;

2-[3-(2-([2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino)-2-metilpropil)fenil]-N-(2-fenoxietyl)acetamida;

2-[3-(2-([2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino)-2-metilpropil)fenil]-N-[(1S)-2-hidroxi-1-metiletil]acetamida;

2-[3-(2-([2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino)-2-metilpropil)fenil]-N-[(1S)-1-(hidroximetil)-2-metilpropil]acetamida;

2-[3-(2-([2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino)-2-metilpropil)fenil]-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-metilbutil]acetamida;

N-[(1R)-1-bencil-2-hidroxietyl]-2-[3-(2-([2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino)-2-metilpropil)fenil]acetamida;

2-[3-(2-([2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino)-2-metilpropil)fenil]-N-[(1R)-1-(hidroximetil)propil]acetamida;

2-[3-(2-([2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino)-2-metilpropil)fenil]-N-[(1S)-1-(hidroximetil)-2,2-dimetilpropil]acetamida;

N-[(1S)-2-ciclohexil-1-(hidroximetil)etil]-2-[3-(2-([2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino)-2-metilpropil)fenil]acetamida;

2-[3-(2-([2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino)-2-metilpropil)fenil]-N-[(1S,2R)-2-hidroxi-2,3-dihidro-1H-inden-1-il]acetamida;

2-[3-(2-([2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino)-2-metilpropil)fenil]-N-(2-propoxietyl)acetamida;

2-[3-(2-([2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino)-2-metilpropil)fenil]-N-(4-hidroxiciclohexil)acetamida;

2-[3-(2-([2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino)-2-metilpropil)fenil]-N-(3-propoxipropil)acetamida;

2-[3-(2-([2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino)-2-metilpropil)fenil]-N-etil-N-(2-hidroxietyl)acetamida;

1-([3-(2-([2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino)-2-metilpropil)fenil]acetil)piperidina-4-carboxamida;

5-[2-([2-([3-[2-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]fenil)-1,1-dimetiletil]amino)-1-

434 ✓

hidroxietil}benceno-1,3-diol;

5-{2-[(2-{3-[2-(3,4-dihidroisoquinolin-2(1*H*)-il)-2-oxoetil]fenil}-1,1-dimetiletil)amino]-1-hidroxietil}benceno-1,3-diol;

N-bencil-2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietil]amino}-2-metilpropil)fenil]-*N*-metilacetamida;

5-(1-hidroxi-2-{[2-(3-{2-[4-(2-hidroxietil)piperazin-1-il]-2-oxoetil}fenil)-1,1-dimetiletil]amino}etil)benceno-1,3-diol;

5-{2-[(2-(3-{2-[4-(4-clorofenil)-4-hidroxipiperidin-1-il]-2-oxoetil}fenil)-1,1-dimetiletil]amino)-1-hidroxietil}benceno-1,3-diol;

5-{2-[(1,1-dimetil-2-{3-[2-(4-metilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]fenil}etil)amino]-1-hidroxietil}benceno-1,3-diol;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietil]amino}-2-metilpropil)fenil]-*N*-metil-*N*-(2-feniletil)acetamida;

5-{2-[(1,1-dimetil-2-{3-[2-oxo-2-(4-piridin-2-ilpiperazin-1-il)etil]fenil}etil)amino]-1-hidroxietil}benceno-1,3-diol;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietil]amino}-2-metilpropil)fenil]-*N*-[3-(dimetilamino)propil]-*N*-metilacetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietil]amino}-2-metilpropil)fenil]-*N*-(2-hidroxietil)-*N*-propilacetamida;

N-[2-(dietilamino)etil]-2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietil]amino}-2-metilpropil)fenil]-*N*-metilacetamida;

5-{2-[(1,1-dimetil-2-{3-[2-(4-metil-1,4-diazepan-1-il)-2-oxoetil]fenil}etil)amino]-1-hidroxietil}benceno-1,3-diol;

5-[2-({1,1-dimetil-2-[3-(2-morfolin-4-il-2-oxoetil)fenil]etil}amino)-1-hidroxietil]benceno-1,3-diol;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietil]amino}-2-metilpropil)fenil]-*N*-metil-*N*-[(1*S*)-1-feniletil]acetamida;

5-[2-({1,1-dimetil-2-[3-(2-oxo-2-piperidin-1-ilet)fenil]etil}amino)-1-hidroxietil]benceno-1,3-diol;

5-(1-hidroxi-2-{[2-(3-{2-[(3*R*)-3-hidroxipirrolidin-1-il]-2-oxoetil}fenil)-1,1-dimetiletil]amino}etil)benceno-1,3-diol;

5-(1-hidroxi-2-{[2-(3-{2-[(3*R*)-3-hidroxipiperidin-1-il]-2-oxoetil}fenil)-1,1-dimetiletil]amino}etil)benceno-1,3-diol;

5-{2-[(2-{3-[2-(4-acetil-1,4-diazepan-1-il)-2-oxoetil]fenil}-1,1-dimetiletil)amino]-1-hidroxietil}benceno-1,3-diol;

5-(1-hidroxi-2-{[2-(3-{2-[4-(hidroximetil)piperidin-1-il]-2-oxoetil}fenil)-1,1-dimetiletil]amino}etil)benceno-1,3-diol;

N-(1-{[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietil]amino}-2-

435 X6

metilpropil)fenil]acetil}pirrolidin-3-il)-*N*-metilacetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-*N*-(2-metoxietyl)-*N*-propilacetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-*N*-etil-*N*-(2-metoxietyl)acetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-*N*-[3-(dimetilamino)-2,2-dimetilpropil]acetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-*N*-[3-fluoro-5-(trifluorometil)bencil]acetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-*N*-[(1*S*)-1-(hidroximetil)-3-metilbutil]acetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-*N*-[(1*S*)-2-hidroxi-1-feniletil]acetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-*N,N*-dietilacetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-*N*-1*H*-pirazol-5-ilacetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-*N*-(5-metil-1*H*-pirazol-3-il)acetamida;

N-(ciclohexilmetil)-2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]acetamida;

4-{[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]acetil}piperazin-1-carboxilato de etilo;

N-(5-Cloropiridin-2-il)-2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]acetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-*N*-(6-metilpiridin-2-il)acetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-*N*-(3-metilpiridin-2-il)acetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-*N*-isoquinolin-1-ilacetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-*N*-(4,6-dimetilpiridin-2-il)acetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-*N*-(2-metoxibencil)acetamida;

N-[(1*S*)-1-bencil-2-hidroxietyl]-2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]acetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietyl]amino}-2-metilpropil)fenil]-*N*-(1-etil-

936

1*H*-pirazol-5-il)acetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietil]amino}-2-metilpropil)fenil]-*N*-(1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il)acetamida;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietil]amino}-2-metilpropil)fenil]-*N*-(3-fluorobencil)acetamida;

1-{[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietil]amino}-2-metilpropil)fenil]acetil}-*L*-prolinamida;

5-{2-[(2-{3-[2-(5-amino-3-terc-butil-1*H*-pirazol-1-il)-2-oxoetil]fenil}-1,1-(metiletil)amino]-1-hidroxietil}benceno-1,3-diol;

2-[3-(2-{[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxietil]amino}-2-metilpropil)fenil]-*N*-[(1*S*)-1-feniletil]acetamida;

5-{2-[(2-{3-[2-(1,4-dioxa-8-azaespiro[4,5]dec-8-il)-2-oxoetil]fenil}-1,1-dimetiletil)amino]-1-hidroxietil}benceno-1,3-diol;

N-[2-(4-Cloro-fenil)-etil]-3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxietilamino]-2-metilpropil}-benzamida;

N-Adamantan-1-il-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-fenil)-acetamida;

3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-*N*-[2-(3-fluoro-fenil)-etil]-benzamida;

N-[2-(2-Cloro-fenil)-etil]-3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxietilamino]-2-metilpropil}-benzamida;

3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-*N*-[2-(2,3-dimetil-fenil)-etil]-benzamida;

N-[2-(2-Cloro-4-fluoro-fenil)-etil]-3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-benzamida;

3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-*N*-[2-(4-metoxi-2,3-dimetil-fenil)-etil]-benzamida;

N-(3,4-Dicloro-bencil)-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxietilamino]-2-metilpropil}-fenil)-acetamida;

N-(3,4-Dicloro-bencil)-3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metilpropil}-benzamida;

N-(4-Cloro-bencil)-3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metilpropil}-benzamida;

N-Adamantan-1-il-3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metilpropil}-benzamida;

N-(4-Cloro-bencil)-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metilpropil}-fenil)-acetamida;

N-(4-Trifluorometoxibencil)-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxietilamino]-2-

437 /

metil-propil}-fenil)-acetamida;

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-fenil)-*N*-piridin-2-il-metil-acetamida;

N-(3,4-Dicloro-bencil)-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-fenil)-acetamida;

N-(Bencil)-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-fenil)-acetamida;

N-Ciclohexilmetil-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-fenil)-acetamida;

1-(3,4-Dihidro-1*H*-isoquinolin-2-il)-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-fenil)-etanona;

N-Bencil-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-fenil)-*N*-metil-acetamida;

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-fenil)-*N*-(2-hidroxi-bencil)-acetamida;

N-(4-Ciano-bencil)-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-fenil)-acetamida;

N-(2,4-Dicloro-bencil)-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-fenil)-acetamida;

N-(Bencil)-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metilpropil}-fenil)-acetamida;

N-(2-Clorobencil)-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-fenil)-acetamida;

N-(3-Metoxibencil)-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-fenil)-acetamida;

N-(Ciclohexilmetil)-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-fenil)-acetamida;

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-fenil)-*N*-fenetil-acetamida;

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-fenil)-*N*-(4-clorofenetil)-acetamida;

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-fenil)-*N*-(4-fenilfenetil)-acetamida;

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-fenil)-*N*-(4'-hidroxi-bifenil-3-ilmetil)-acetamida;

N-Cicloheptil-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-fenil)-acetamida;

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-fenil)-*N*-fenetil-

23

acetamida;

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-fenil)-N-(2-metilsulfanil-bencil)-acetamida;

N-(2,6-Dicloro-bencil)-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-fenil)-acetamida;

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-fenil)-N-indan-2-il-acetamida;

N-(2-Cloro-6-fluorobencil)-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-fenil)-acetamida;

N-(4-Clorobencil)-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-fenil)-acetamida;

N-(2,5-Dicloro-bencil)-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-fenil)-acetamida;

N-(3,5-Dicloro-bencil)-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-fenil)-acetamida;

N-(2,6-Dicloro-bencil)-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-fenil)-acetamida;

N-Bifenil-2-ilmetil-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-fenil)-acetamida;

N-(2-Clorobencil)-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-fenil)-acetamida;

N-(3-Metoxibencil)-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-fenil)-acetamida;

N-(3-Trifluorometilbencil)-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-fenil)-acetamida;

N-(3,4-Difluorobencil)-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-fenil)-acetamida;

N-(2-Metoxibencil)-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-fenil)-acetamida;

N-(3,4-Dimetilbencil)-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-fenil)-acetamida;

N-(3,4-Dimetoxibencil)-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-fenil)-acetamida;

4-{[2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-fenil)-acetilamino]-metil}-benzamida;

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-fenil)-N-indan-1-il-acetamida;

3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-N-[2-(3-fluorofenil)-etil]-

benzamida;

3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-N-[2-(2-clorofenil)-etil]-

benzamida;

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-fenil)-N-naftalen-1-

ilmetil-acetamida;

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-fenil)-N-(2-fluoro-5-

trifluorometil-bencil)-acetamida;

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-fenil)-N-(3-

clorobencil)-acetamida;

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-fenil)-N-(4-fluoro-3-

trifluorometil-bencil)-acetamida;

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-fenil)-N-(2-

metilsulfanil-bencil)-acetamida;

4-{[2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-fenil)-

acetilamino]-metil}-benzamida;

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-fenil)-N-(4-

sulfamoil-bencil)-acetamida;

Éster metílico del ácido 4-{[2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-

metil-propil}-fenil)-acetilamino]-metil}-benzoico;

N-(1-Bencil-piperidin-4-il)-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-

metil-propil}-fenil)-acetamida;

3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-N-[2-fenetil]-benzamida;

3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-N-[2-(5-fluoro-2-metil-

fenil)-etil]-benzamida;

3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-N-[2-(2-trifluorometil-

fenil)-etil]-benzamida;

3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-N-(2-naftalen-1-il-etil)-

benzamida;

3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-N-[2-(2,4,5-trimetil-

fenil)-etil]-benzamida;

3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-N-[2-(2,3-dimetil-fenil)-

etil]-benzamida;

3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-N-[2-(2-hidroxi-3-cloro-

fenil)-etil]-benzamida;

3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-N-[2-(4-clorofenil)-etil]-

benzamida;

3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-N-[2-(2-hidroxi-5-cloro-

fenil)-etil]-benzamida;

940 ✓

3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-propil}-N-[2-(2-cloro-4-fluoro-fenil)-etil]-benzamida;

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-fenil)-N-(2-metil-bencil)-acetamida;

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-fenil)-N-(3-metil-bencil)-acetamida;

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-fenil)-N-(4-metil-bencil)-acetamida;

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-fenil)-N-(2-metoxi-bencil)-acetamida

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-fenil)-N-(4-metoxi-bencil)-acetamida;

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-fenil)-N-(2,3-dimetil-bencil)-acetamida;

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-fenil)-N-(3,4-dimetil-bencil)-acetamida;

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-fenil)-N-(2-cloro-6-metil-bencil)-acetamida;

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-fenil)-N-(3-cloro-4-metil-bencil)-acetamida;

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxi-fenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metil-propil}-fenil)-N-[2-(6-metoxi-naftalen-2-il)-etil]-acetamida;

N-(2-Clorobencil)-3-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxi-etilamino]propil}fenil)propionamida;

N-(2,6-Diclorobencil)-3-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxi-etilamino]propil}fenil)propionamida;

1-(3,4-Dihidro-1H-isoquinolin-2-il)-3-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxi-etilamino]propil}fenil)propan-1-ona;

N-(2-Cloro-4-fluorobencil)-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxi-etilamino]propil}fenil)acetamida;

N-(4-Bromobencil)-2-(3-{2-[2-(3,5-dihidroxifenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metilpropil}fenil)acetamida;

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxifenil)-2-hidroxi-etilamino]-2-metilpropil}fenil)-N-(3,4-dimetilfenil)acetamida;

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxifenil)-2-hidroxi-etilamino]propil}fenil)-N-(2,3-dimetilbencil)acetamida;

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxifenil)-2-hidroxi-etilamino]propil}fenil)-N-(4-fluorobencil)acetamida;

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxifenil)-2-hidroxiethylamino]propil}fenil)-1-(4-piridin-2-ilpiperazin-1-il)etanona; y,

2-(3-{2-[2-(3,5-Dihidroxifenil)-2-hidroxiethylamino]-2-metilpropil}fenil)-N-(2-fenilpropil)acetamida.

13. Una composición farmacéutica que comprende al menos una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula (1) como se describe en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12 o una sal farmacéuticamente aceptable o forma derivada del mismo.

14. Un compuesto de la fórmula (1) como se describe en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12 o una sal farmacéuticamente aceptable, forma derivada o composición del mismo, para uso como un medicamento.

15. El uso de un compuesto de fórmula (1) como se describe en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12 o de una sal farmacéuticamente aceptable, solvato o composición del mismo, para la fabricación de un fármaco para el tratamiento de enfermedades, trastornos y afecciones seleccionados entre el grupo que consta de:

- asma de cualquier tipo, etiología o patogénesis, en particular asma que es un miembro seleccionado entre el grupo compuesto por asma atópica, asma no atópica, asma alérgica, asma atópica bronquial mediada por IgE, asma bronquial, asma esencial, asma verdadera, asma intrínseca causada por alteraciones patofisiológicas, asma extrínseca causada por factores medioambientales, asma esencial de origen desconocido o inaparente, asma no atópica, asma bronquítica, asma enfisematosa, asma inducida por el ejercicio, asma inducida por alérgenos, asma inducida por aire frío, asma ocupacional, asma infecciosa causada por infección por bacterias, hongos, protozoos o virus, asma no alérgica, asma incipiente, síndrome sibilante en niños y bronquiolitis,

- broncoconstricción crónica o aguda, bronquitis crónica, obstrucción de las vías respiratorias inferiores y enfisema,

- enfermedades obstructivas o inflamatorias de las vías respiratorias de cualquier tipo, etiología o patogénesis, en particular, una enfermedad obstructiva o inflamatoria de las vías respiratorias que es un miembro seleccionado entre el grupo compuesto por neumonía eosinofílica crónica, enfermedad pulmonar obstructiva crónica

442 12

(COPD), COPD que incluye bronquitis crónica, enfisema pulmonar o disnea asociada o no asociada con COPD, COPD caracterizada por obstrucción irreversible y progresiva de las vías respiratorias, síndrome de insuficiencia respiratoria en adultos (ARDS), exacerbación de la hiperreactividad de las vías respiratorias posterior a una terapia con otros fármacos y enfermedad de las vías respiratorias asociada con hipertensión pulmonar,

- bronquitis de cualquier tipo, etiología o patogénesis, en particular bronquitis que es un miembro seleccionado entre el grupo compuesto por bronquitis aguda, bronquitis laringotraqueal aguda, bronquitis araquídica, bronquitis catarral, bronquitis con laringotraqueítis, bronquitis seca, bronquitis asmática infecciosa, bronquitis productiva, bronquitis por estafilococos o estreptococos y bronquitis vesicular,

- lesión pulmonar aguda,

- bronquiectasia de cualquier tipo, etiología o patogénesis, en particular bronquiectasia que es un miembro seleccionado entre el grupo compuesto por bronquiectasia cilíndrica, bronquiectasia saculada, bronquiectasia fusiforme, bronquiectasia capilar, bronquiectasia quística, bronquiectasia seca y bronquiectasia folicular.

16. Combinación de un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 15 con otros agentes terapéuticos seleccionados entre:

(a) Inhibidores de 5-lipoxigenasa (5-LO) o antagonistas de la proteína de activación de la 5-lipoxigenasa (FLAP),

(b) Antagonistas de leucotrienos (LTRA), incluyendo antagonistas de LTB₄, LTC₄, LTD₄ y LTE₄,

(c) Antagonistas de receptores de histamina, incluyendo antagonistas de H₁ y H₃,

(d) Agentes simpatomiméticos vasoconstrictores agonistas del adrenoceptor α_1 y α_2 para uso descongestivo,

(e) Antagonistas del receptor muscarínico M₃ o agentes anticolinérgicos,

(f) Inhibidores de PDE, por ejemplo inhibidores de PDE3, PDE4 y PDE5,

(g) Teofilina

(h) Cromoglicato sódico,

(i) Inhibidores de COX, inhibidores selectivos y no selectivos de COX-1 o COX-2 (NSAID) ;

(j) Glucocorticosteroides orales e inhalados, tales como DAGR (agonistas disociados del receptor de corticoides)

(k) Anticuerpos monoclonales activos contra entidades inflamatorias endógenas,

- (l) Agentes contra el factor de necrosis tumoral α (anti-TNF- α)
- (m) Inhibidores de moléculas de adhesión incluyendo antagonistas de VLA-4
- (n) Antagonistas del receptor de quinina B₁ y B₂
- (o) Agentes inmunosupresores,
- (p) Inhibidores de metaloproteasas de matriz (MMP),
- (q) Antagonistas de receptores de taquiquinina NK₁, NK₂ y NK₃,
- (r) Inhibidores de elastasa,
- (s) Agonistas del receptor de adenosina A2a,
- (t) Inhibidores de uroquinasa,
- (u) Compuestos que actúan sobre los receptores de dopamina, por ejemplo agonistas D2,
- (v) Moduladores de la ruta de NF κ B, por ejemplo inhibidores de IKK,
- (w) Moduladores de las rutas de señalización de citoquinas tales como un inhibidor de la quinasa p38 MAP, la quinasa syk o la quinasa JAK,
- (x) Agentes que pueden clasificarse como mucolíticos o anti-tusivos, y
- (y) Antibióticos.
