

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

P2006/000211

SOLICITUD DE:

1

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Solicitud.

2

SOLICITANTE
(71)

Nombre: PFIZER PRODUCTS INC

Dirección: Eastern Poit Road, Groton,
Connecticut 06340 E.U.A.

Nacionalidad o Domicilio: Estadounidense

Lugar de Constitución: Delaware, Estados
Unidos de América

Teléfono: _____

Fax: _____

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: 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:

06-113.679

5

Descripción de la corrección o modificación solicitada Por favor ver pagina adjunta

6

Comprobante de pago No. 07-95.327

Fecha

23 de Noviembre 2007

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

255 258
25

MODIFICACIONES EXPEDIENTE No. 06-113.679

Me permito presentar un Capítulo Reivindicatorio Modificado, en el que se realizaron los siguientes cambios:

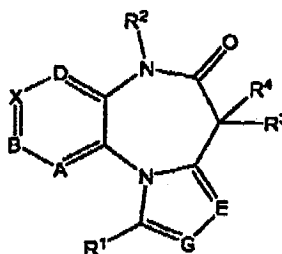
- Se elimina la posibilidad en la Reivindicación 1 que los compuestos de Fórmula I comprendan “un heterociclo-B de 4 a 7 miembros parcial o completamente saturado”
- Se elimina la dependencia de la Reivindicación 8 para hacerla una Reivindicación independiente.

Valga anotar que las anteriores modificaciones cumplen a cabalidad con lo estipulado en el Artículo 34 de la Decisión 486 de la CAN, ya que éstas de ninguna manera implican una ampliación de la protección correspondiente a la divulgación contenida en la solicitud inicial; por el contrario, corresponden a una franca limitación de la materia reivindicada inicialmente.

256 259
K**CAPÍTULO REIVINDICATORIO MODIFICADO**

(modificaciones voluntarias)

1. Un compuesto de fórmula (I)



(I)

5

en la que A, B, X, D, E y G son independientemente -C(R⁵)- o -N-;

con la condición de que no más de dos de A, B, X y D son N al mismo tiempo y al menos uno de E y G es N;

10 R¹ se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo (C₂-C₆), alquilo (C₁-C₆) halo-sustituido, alquilamino (C₁-C₆), di(alquil C₁-C₆)amino, alquilamino (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), di-
alquilamino (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), arilo, aril-alquilo (C₁-C₆), heteroaril-A, heteroaril-A-alquilo (C₁-C₆), un heterociclo-A de
15 4 a 7 miembros parcial o completamente saturado, un heterociclo-A-alquilo (C₁-C₆) de 4 a 7 miembros parcial o completamente saturado y un cicloalquil (C₃-C₇)-alquilo (C₁-C₆) parcial o completamente saturado y, cuando ninguno de R⁶ y R⁷ es fenilmetilo, R¹ se selecciona entre dicho grupo y cicloalquilo (C₃-C₇)
20 parcial o completamente saturado;

en que heteroaril-A se selecciona entre el grupo que consiste en tienilo, tiazolilo, isotiazolilo, indolilo, 2-piridilo, piridazinilo, pirimidilo, oxazolilo, furanilo, imidazolilo, isoxazolilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzotiofenilo,
25 lo, benzofuranilo, pirazinilo y pirazolilo,

y el heterociclo-A parcial o completamente saturado se selecciona entre el grupo que consiste en piranilo, morfolinilo y tetrahidrofuranilo,

y en donde el arilo, heteroaril-A, heterociclo-A parcial o completamente saturado o el grupo cicloalquilo parcial o completamente saturado o parte de un grupo está opcionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyentes independientemente seleccionados entre el grupo que consiste en halo, alcoxi (C₁-C₃), alcoxi (C₁-C₃) halo-sustituido, -OH, alquilo (C₁-C₃), -CN y alquilo (C₁-C₃) halo-sustituido;

R² es -CH₂C(O)N(R⁶)(R⁷);

uno de R³ y R⁴ es H, halo, alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆) o un cicloalquilo (C₃-C₇) parcial o completamente saturado y el otro de R³ y R⁴ es -C(R⁸)(R⁹)(R¹⁰); o

R³ y R⁴ se toman conjuntamente para formar =CHR¹¹;

cada R⁵ se selecciona independientemente entre el grupo que consiste en H, alcoxi (C₁-C₆), -OH, halo, -CN, -NH₂ y -NO₂;

uno de R⁶ y R⁷ es alquilo (C₃-C₆) o un cicloalquilo (C₃-C₇) parcial o completamente saturado y el otro de R⁶ y R⁷ es fenilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyentes independientemente seleccionados entre el grupo que consiste en -OH, -CN, halo, alquilo (C₁-C₆) halo-sustituido, alcoxi (C₁-C₃) halo-sustituido, alquilo (C₁-C₆) y alcoxi (C₁-C₃); fenilmetilo en el que el resto fenilo está opcionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyentes independientemente seleccionados entre el grupo que consiste en -OH, -CN, alquilo (C₁-C₆) halo-sustituido, alcoxi (C₁-C₃) halo-sustituido y alcoxi (C₁-C₃); o heteroaril-B opcionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyentes independientemente seleccionados entre el grupo que consiste en -OH, -CN, halo, alquilo (C₁-C₆) halo-sustituido, alcoxi (C₁-C₃) halo-sustituido, alquilo (C₁-C₆) y alcoxi (C₁-C₃); y en que dicho heteroaril-B se selecciona entre el grupo que consiste en tienilo, tiazolilo, isotiazolilo, isoquinolinilo, quinolinilo, 3-ó 4-piridilo, pirimidilo, oxazolilo, furanilo, imidazolilo, isoxazolilo, pirazinilo, piridazinilo y pirazolilo;

dos de R⁸, R⁹ y R¹⁰ son independientemente H o alquilo (C₁-C₆) y el otro de R⁸, R⁹ y R¹⁰ es fenilo, un cicloalquilo (C₃-C₇) parcial o completamente saturado o heteroaril-C, en que hete-

2525E
2/5/1
6

roaril-C se selecciona entre el grupo que consiste en indol-2-ilo, indol-3-ilo, indazol-3-ilo, 7-azaindol-2-ilo y 7-azaindol-3-ilo; y dicho fenilo, cicloalquilo parcial o completamente saturado o heteroaril-C que está opcionalmente sustituido en el

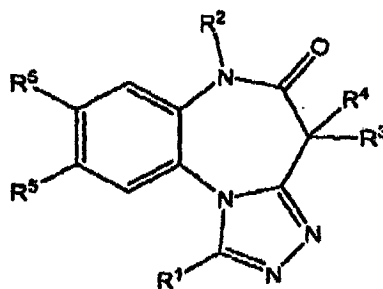
5 (o los) átomo(s) de carbono con 1 a 3 sustituyentes independientemente seleccionados entre el grupo que consiste en alcoxi (C₁-C₆), F, Cl, -CN, -OH, -CO₂H, tetrazol y alcoxi (C₁-C₆) halo-sustituido; y

R¹¹ es fenilo, un cicloalquilo (C₃-C₇) parcial o completamente saturado o heteroaril-C, en donde heteroaril-C se selecciona entre el grupo que consiste en indol-2-ilo, indol-3-ilo, indazol-3-ilo, 7-azaindol-2-ilo y 7-azaindol-3-ilo; dicho fenilo, cicloalquilo parcial o completamente saturado o heteroaril-C que está opcionalmente sustituido en el (o los) átomo(s) de

15 carbono con 1 a 3 sustituyentes independientemente seleccionados entre el grupo que consiste en alcoxi (C₁-C₆), F, Cl, -CN, -OH, -CO₂H, tetrazol y alcoxi (C₁-C₆) halo-sustituido; una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, un profármaco de dicho compuesto o dicha sal o un solvato o hidrato de dicho compuesto, dicha sal o dicho profármaco.

20

2. El compuesto según la reivindicación 1, de fórmula (III)



(III)

25 en la que R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ son como se definen en la reivindicación 1; o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

259
262
9

3. El compuesto según las reivindicaciones 1 ó 2, en el cual

uno de R^3 y R^4 es H, alquilo (C_1-C_3) o alcoxi (C_1-C_3), y el
5 otro de R^3 y R^4 es $-C(R^8)(R^9)(R^{10})$; o

R^3 y R^4 se toman conjuntamente para formar $=CHR^{11}$;

R^1 se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo (C_2-C_6), $-CF_3$, fenilo, fenil-alquilo (C_1-C_3), heteroaril-A, heteroaril-A-alquilo (C_1-C_3), un heterociclo-A de 4 a 7 miembros parcial o completamente saturado, un heterociclil-A-alquilo (C_1-C_3) de 4 a 7 miembros parcial o completamente saturado y un cicloalquil (C_3-C_7)-alquilo (C_1-C_3) parcial o completamente saturado, y cuando ninguno de R^6 y R^7 es fenilmetilo, R^1
10 se selecciona entre dicho grupo y cicloalquilo (C_3-C_7) parcial o completamente saturado,
15

en que heteroaril-A se selecciona entre el grupo que consiste en tienilo, 2-piridilo, pirimidilo, pirazinilo y pirazolilo; y

en que el fenilo, heteroaril-A, heterocilo-A parcial o completamente saturado o grupo cicloalquilo parcial o completamente saturado o parte de un grupo está opcionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyentes independientemente seleccionados entre el grupo que consiste en F, Cl, alcoxi (C_1-C_3), $-OH$, alquilo (C_1-C_3), $-CN$ y $-CF_3$; o una sal farmacéuticamente aceptable
20 del mismo.
25

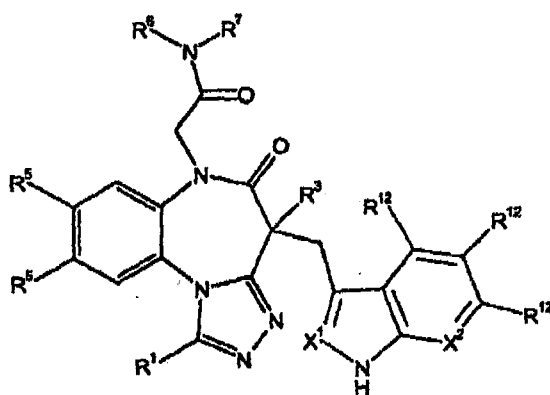
4. El compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1-3, en el cual

cada R^5 es H;

30 uno de R^6 y R^7 es alquilo (C_3-C_6) de cadena ramificada y el otro de R^6 y R^7 es fenilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyentes independientemente seleccionados entre el grupo que consiste en $-OH$, $-CN$, F, Cl, alquilo (C_1-C_3) sustituido con F o Cl, alcoxi (C_1-C_3) sustituido con F o Cl, alquilo (C_1-C_4) y
35 alcoxi (C_1-C_3); fenilmetilo en el que el resto fenilo está op-

260
~~263~~
8

- cionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyentes independiente-
mente seleccionados entre el grupo que consiste en -OH, -CN y
alcoxi (C₁-C₃); o heteroaril-B opcionalmente sustituido con 1 a
3 sustituyentes independientemente seleccionados entre el grupo
que consiste en -OH, -CN, F, Cl, alquilo (C₁-C₃) sustituido con
F o Cl, alcoxi (C₁-C₃) sustituido con F o Cl, alquilo (C₁-C₄) y
alcoxi (C₁-C₃); y en que dicho heteroaril-B se selecciona entre
el grupo que consiste en tienilo, 3- ó 4-piridilo, pirimidilo y
pirazinilo;
- dos de R⁸, R⁹ y R¹⁰ son H y el otro de R⁸, R⁹ y R¹⁰ es hete-
roaril-C seleccionado entre el grupo que consiste en indol-3-
ilo, indazol-3-ilo y 7-azaíndol-3-ilo, y dicho heteroaril-C es-
tá opcionalmente sustituido en el (o los) átomo(s) de carbono
con 1 a 3 sustituyentes independientemente seleccionados entre
el grupo que consiste en alcoxi (C₁-C₃), F, Cl, -CN, -OH, -CO₂H,
tetrazol y alcoxi (C₁-C₃) sustituido con F; y
- R¹¹ es un heteroaril-C seleccionado entre el grupo que
consiste en indol-3-ilo, indazol-3-ilo y 7-azaíndol-3-ilo, y
dicho heteroaril-C está opcionalmente sustituido en el (o los)
átomo(s) de carbono con 1 a 3 sustituyentes independientemente
seleccionados entre el grupo que consiste en alcoxi (C₁-C₃), F,
Cl, -CN, -OH, -CO₂H, tetrazol y alcoxi (C₁-C₃) sustituido con F;
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
5. El compuesto según una cualquiera de las reivindicacio-
nes 1-4, de fórmula (IV)



(IV)

en el cual

R^3 es H o alquilo (C_1-C_3);

X^1 es $-CH-$ y X^2 es $-N-$ o $-C(R^{12})-$, o X^1 es $-N-$ y X^2 es $-$

5 $C(R^{12})-$; y

cada R^{12} se selecciona independientemente entre el grupo que consiste en H, F y Cl; con la condición, sin embargo, de que no más de tres de R^{12} son distintos de H; o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

10

6. El compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1-5, en el cual

15 R^1 es fenilo o 2-piridilo o, cuando ninguno de R^6 y R^7 es fenilmetilo, R^1 puede ser también un cicloalquilo (C_5-C_7) parcial o completamente saturado, en que el fenilo, 2-piridilo o cicloalquilo (C_5-C_7) parcial o completamente saturado está opcionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyentes independientemente seleccionados entre el grupo que consiste en F, Cl, alcoxi (C_1-C_3), $-OH$, alquilo (C_1-C_3) y $-CF_3$;

20

R^3 es H;

uno de R^6 y R^7 es un alquilo (C_3-C_5) de cadena ramificada y el otro de R^6 y R^7 es fenilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyentes independientemente seleccionados entre el grupo que consiste en $-OH$, $-CN$, F, Cl, alquilo (C_1-C_3) sustituido con F, alcoxi (C_1-C_3) sustituido con F, alquilo (C_1-C_4) y alcoxi

25

262
265
17

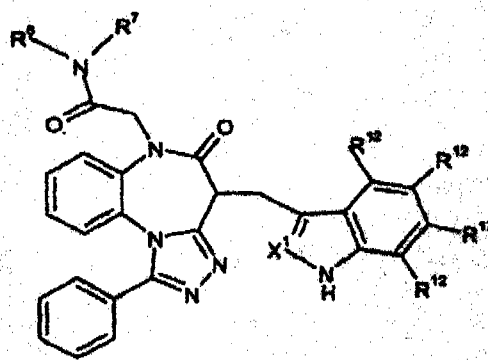
(C₁-C₃); fenilmetilo opcionalmente sustituido con 1 ó 2 sustituyentes independientemente seleccionados entre el grupo que consiste en -OH y -OCH₃; o 3- ó 4-piridilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyentes independientemente seleccionados entre el grupo que consiste en -OH, -CN, F, Cl, alquilo (C₁-C₃) sustituido con F, alcoxí (C₁-C₃) sustituido con F, alquilo (C₁-C₄) y alcoxí (C₁-C₃); o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

10 7. El compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1-6, en el cual

R¹ es fenilo, o ciclohexilo cuando ninguno de R⁶ y R⁷ es fenilmetilo, en que el fenilo está opcionalmente sustituido con 1 a 3 átomos de F o un grupo -OH;

15 uno de R⁶ y R⁷ es alquilo (C₃ o C₄) de cadena ramificada y el otro de R⁶ y R⁷ es fenilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyentes independientemente seleccionados entre el grupo que consiste en -OH, F, Cl, -CF₃, -OCF₃, alquilo (C₁-C₄) y alcoxí (C₁-C₃); fenilmetilo; o 3- ó 4-piridilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyentes independientemente seleccionados entre el grupo que consiste en -OH, F, Cl, -CF₃, -OCF₃, alquilo (C₁-C₄) y alcoxí (C₁-C₃); o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

25 8. Un compuesto de Fórmula (V)



(V)

263
266
H

en el cual

X¹ es -CH- o -N-; y

uno de R⁶ y R⁷ es isopropilo y el otro de R⁶ y R⁷ es fenilo
opcionalmente sustituido con 1 ó 2 átomos de F; fenilmetilo; o
5 3- ó 4-piridilo opcionalmente sustituido con 1 ó 2 sustituyen-
tes independientemente seleccionados entre el grupo que consis-
te en F, Cl, -OCH₃ y -OCH₂CH₃; y cada R¹² es independientemente
H o F; con la condición, sin embargo de que no más de tres de
R¹² son F; o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

10

9. El compuesto según una cualquiera de las reivindicacio-
nes 1-8, en el que X¹ es -CH-;

uno de R⁶ y R⁷ es isopropilo y el otro de R⁶ y R⁷ es fenilo
o fenilmetilo; y cada R¹² es H; o una sal farmacéuticamente
15 aceptable del mismo.

10. El compuesto según una cualquiera de las reivindica-
ciones 1-8, en el que X¹ es -CH-;

uno de R⁶ y R⁷ es isopropilo y el otro de R⁶ y R⁷ es 3-
20 piridilo opcionalmente sustituido con 1 ó 2 sustituyentes inde-
pendientemente seleccionados entre el grupo que consiste en F,
Cl, -OCH₃ y -OCH₂CH₃; y cada R¹² es H; o una sal farmacéutica-
mente aceptable del mismo.

25 11. El compuesto N-bencil-2-[4-(1H-indol-3-ilmetil)-5-oxo-
1-fenil-4,5-dihidro-2,3,6,10b-tetraaza-benzo[e]azulen-6-il]-N-
isopropil-acetamida; o una sal farmacéuticamente aceptable del
mismo.

30 12. El compuesto (-)N-bencil-2-[4-(1H-indol-3-ilmetil)-5-
oxo-1-fenil-4,5-dihidro-2,3,6,10b-tetraaza-benzo[e]azulen-6-
il]-N-isopropil-acetamida.

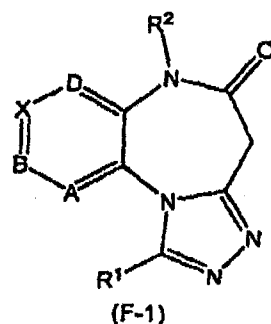
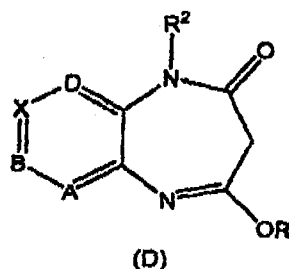
35 13. Una composición farmacéutica, que comprende un com-
puesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1-12 o una

264
267
17

sal farmacéuticamente aceptable del mismo y un excipiente, diluyente o vehículo farmacéuticamente aceptable.

14. Un método para tratar la obesidad en un animal, que comprende administrar a un animal que necesita este tratamiento una cantidad terapéuticamente eficaz de un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1-12 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

15. Un compuesto de Fórmula (D) o Fórmula (F-1)



en la que A, B, X y D son independientemente -C(R⁵)- o -N-

15 con la condición de que no más de dos A, B, X y D son N al mismo tiempo;

R es alquilo (C₁-C₆) o cicloalquilo (C₃-C₆);

20 R¹ se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo (C₂-C₆), alquilo (C₁-C₆) halo-sustituido, alquilamino (C₁-C₆), di(alquil C₁-C₆)amino, alquilamino (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), di-alquilamino (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), arilo, aril-alquilo (C₁-C₆),

265
~~268~~
173

heteroaril-A, heteroaril-A-alquilo (C_1-C_6), un heterociclo-A de 4 a 7 miembros parcial o completamente saturado, un heterociclil-A-alquilo (C_1-C_6) de 4 a 7 miembros parcial o completamente saturado y un cicloalquil (C_3-C_7)-alquilo (C_1-C_6) parcial o completamente saturado y, cuando ninguno de R^6 y R^7 es fenilmetilo, R^1 se selecciona entre dicho grupo y cicloalquilo (C_3-C_7) parcial o completamente saturado;

en que heteroaril-A se selecciona entre el grupo que consiste en tienilo, tiazolilo, isotiazolilo, indolilo, 2-piridilo, piridazinilo, pirimidilo, oxazolilo, furanilo, imidazolilo, isoxazolilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzotiofenilo, benzofuranilo, pirazinilo y pirazolilo,

y el heterociclo-A parcial o completamente saturado se selecciona entre el grupo que consiste en piranilo, morfolinilo y tetrahidrofuranilo,

y en donde el arilo, heteroaril-A, heterociclo-A parcial o completamente saturado o el grupo cicloalquilo parcial o completamente saturado o parte de un grupo está opcionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyentes independientemente seleccionados entre el grupo que consiste en halo, alcoxi (C_1-C_3), alcoxi (C_1-C_3) halo-sustituido, -OH, alquilo (C_1-C_3), -CN y alquilo (C_1-C_3) halo-sustituido;

R^2 es $-CH_2C(O)N(R^6)(R^7)$;

cada R^5 se selecciona independientemente entre el grupo que consiste en H, alcoxi (C_1-C_6), -OH, halo, -CN, $-NH_2$ y $-NO_2$;

uno de R^6 y R^7 es alquilo (C_3-C_6) o un cicloalquilo (C_3-C_7) parcial o completamente saturado y el otro de R^6 y R^7 es fenilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyentes independientemente seleccionados entre el grupo que consiste en -OH, -CN, halo, alquilo (C_1-C_6) halo-sustituido, alcoxi (C_1-C_3) halo-sustituido, alquilo (C_1-C_6) y alcoxi (C_1-C_3); fenilmetilo en el que el resto fenilo está opcionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyentes independientemente seleccionados entre el grupo que consiste en -OH, -CN, alquilo (C_1-C_6) halo-sustituido, alcoxi (C_1-C_3) halo-sustituido y alcoxi (C_1-C_3); o heteroaril-B