

154



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-043825- -00003-0000

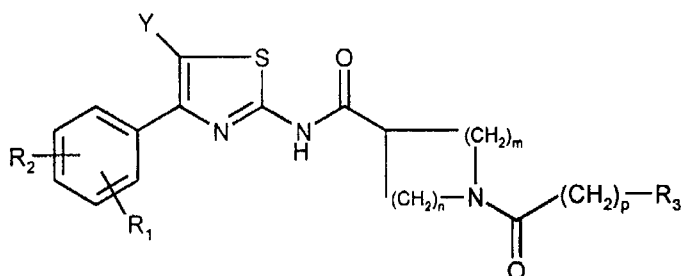
Fecha: 2007-12-15 17:19:51 Dep. 2020 NULCREACIONE
Tra 11 PATENTE LITII Lve 378 FASENACIONALI
Act. 329 CIOINFORMACION Folios. 14

FORMULARIO UNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

1	SOLICITUD DE: ☐ Corrección de Error Material ☒ Modificación a una solicitud	
2	SOLICITANTE Nombre: SANOFI – AVENTIS Sociedad constituida y existente bajo las leyes de Francia. Dirección: 174, Avenue de France, 75013 Paris, Francia Domicilio: Paris, Francia Teléfono: 546 09 70 Fax: 249 40 70 E-mail: clientes@cavelier.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: 217 92 11 E-mail: cavelier@cavelier.com	IDENTIFICACION C.C. ☒ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Número: <u>438.019</u> TP <u>31.929</u>
4	Número de expediente: <u>07.043.825</u>	
5	Descripción de la corrección o modificación solicitada: Presento un nuevo capítulo reivindicatorio compuesto por 11 reivindicaciones, y solicito que el examen de patentabilidad sea efectuado sobre este nuevo pliego reivindicatorio. _____ _____	
6	Comprobante de pago No. <u>07-98,205</u> Fecha: <u>3 de diciembre de 2007</u>	
7	Anexos ☒ Comprobante de pago de la tasa por \$99.000.00 por concepto de modificaciones. ☐ Poderes, si fuere el caso ☐ Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.	
8	NOMBRE: EMILIO FERRERO FIRMA: C.C. 438.019 de Usaquén T.P.A. 31.929	

REIVINDICACIONES

1.- Compuesto de fórmula (I) siguiente:



(I)

en la cual:

- R₁ representa un átomo de hidrógeno o de halógeno, un grupo alquilo-(C₁-C₄), trifluoro-alquilo-(C₁-C₄), hidroxilo, alcoxi-(C₁-C₄), trifluoro-alcoxi-(C₁-C₄), cicloalquil-(C₃-C₁₀)-alcoxi-(C₁-C₄), cicloalquiloxi-(C₃-C₁₀), aliloxi, alquiltio-(C₁-C₄);
 - R₂ representa un átomo de hidrógeno o de halógeno, un grupo hidroxilo, alquilo-(C₁-C₄), trifluoro-alquilo-(C₁-C₄), perfluoro-alquilo-(C₁-C₄), cicloalquilo-(C₃-C₁₀), alcoxi-(C₁-C₄), cicloalquil-(C₃-C₁₀)-alcoxi-(C₁-C₄), cicloalquiloxi-(C₃-C₁₀), aliloxi, cicloalquil-(C₃-C₈)-alquilo-(C₁-C₄);
 - Y representa un átomo de hidrógeno o un halógeno; y
 - R₃ representa:
 - un grupo fenilo, substituido por uno o varios átomos de halógeno y/o por uno o varios grupos:
 - alquilo-(C₁-C₆),
 - alcoxi-(C₁-C₆),
 - NO₂,
 - ciano,
 - COR₄,
 - SO₂R₄,
 - CO₂R₄, en el cual R₄ representa un grupo alquilo-(C₁-C₄),
- y
- (CH₂)_qNR₅R₆ en el cual R₅ y R₆ representan independientemente el uno del otro un átomo de hidrógeno, un

grupo alquilo-(C₁-C₄) o R₅ y R₆ forman juntos con el átomo de nitrógeno al cual están unidos un grupo cicloalquilo de 5 ó 6 eslabones y q representan 0, 1 ó 2;

- un grupo heterocíclico eventualmente substituido por uno o varios halógenos y/o por uno o varios grupos:

alquilo-(C₁-C₄),

hidroxilo,

alcoxi-(C₁-C₄),

ciano,

morfolino,

trifluoro-alquilo-(C₁-C₄),

-COR₄,

-SO₂R₄, en el cual R₄ es tal como se define en lo que precede,

-(CH₂)_qNR₅R₆, en el cual R₅, R₆ y q son tales como se definen en lo que precede,

fenilo,

piridina, y

-SCH₃;

estando el o los átomos de nitrógeno del grupo heterocíclico eventualmente substituidos por un grupo alquilo-(C₁-C₄), estando el o los átomos de nitrógeno del grupo heterocíclico eventualmente bajo su forma de N-óxido;

- un grupo heterobícíclico eventualmente substituido por uno o varios halógenos y/o por uno o varios grupos hidroxilos, alquilo-(C₁-C₄) o alcoxi-(C₁-C₄);

- m representa 2, 3 ó 4;

- n representa 0, 1 ó 2; y

- p representa 0, 1, 2 ó 3.

en el estado de base o de sal de adición a un ácido farmacéuticamente aceptable, en estado de hidratos o de solvatos, así como en forma de enantiómeros, de diastereoisómeros y su mezcla.

2.- Compuesto según la reivindicación 1, de fórmula (I) en la cual:

- R₁ y R₂ son tales como se definen en la reivindicación 1;

- Y representa un átomo de hidrógeno o un halógeno; y

- R₃ representa:

• un grupo fenilo, substituido por uno o varios átomos de halógeno y/o por uno o varios grupos:

Alquilo- (C_1-C_6) ,

Alcoxi- (C_1-C_6) ,

-NO₂,

ciano,

-COR₄,

-SO₂R₄,

-CO₂R₄, en el cual R₄ representa un grupo alquilo- (C_1-C_4) ,

y

-(CH₂)_qNR₅R₆, en el cual R₅, R₆ y q son tales como se definen en la reivindicación 1;

• un grupo heterocíclico eventualmente substituido por uno o varios halógenos y/o por uno o varios grupos:

alquilo- (C_1-C_4) ,

hidroxilo,

alcoxi- (C_1-C_4) ,

ciano,

morfolino,

trifluoro-alquilo- (C_1-C_4) ,

-COR₄,

-SO₂R₄, en el cual R₄ es tal como se define en la reivindicación 1,

-(CH₂)_qNR₅R₆, en el cual R₅, R₆ y q son tales como se definen en la reivindicación 1,

fenilo,

piridina, y

-SCH₃;

estando el o los átomos de nitrógeno del grupo heterocíclico eventualmente substituidos por un grupo alquilo- (C_1-C_4) , estando el o los átomos de nitrógeno del grupo heterocíclico eventualmente bajo su forma de N-óxido;

• un grupo heterobícíclico eventualmente substituido por uno o varios halógenos y/o por uno o varios grupos hidroxilos, alquilo- (C_1-C_4) o alcoxi- (C_1-C_4) ;

- m representa 3;

- n representa 1; y

- p representa 0;

en el estado de base o de sal de adición a un ácido farmacéuticamente aceptable, en estado de hidratos o de

solvatos, así como en forma de enantiómeros, de diastereoisómeros y su mezcla.

3.- Compuesto según la reivindicación 1, de fórmula (I) en la cual:

- R_1 y R_2 son tales como se definen en la reivindicación 1;

- Y es tal como se define en la reivindicación 1; y

- R_3 representa:

• un grupo fenilo, substituido por uno o varios átomos de halógeno y/o por uno o varios grupos:

Alquilo- (C_1-C_6),

Alcoxi- (C_1-C_6),

-NO₂,

ciano,

-COR₄,

-SO₂R₄,

-CO₂R₄, en el cual representando R_4 es un grupo alquilo- (C_1-C_4), y

-(CH₂)_qNR₅R₆, en el cual R_5 , R_6 y q son tales como se definen en la reivindicación 1;

• un grupo piridinilo, pirazinilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazolilo, imidazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, oxazolilo, iso-oxazolilo, oxadiazolilo, tiofenilo, pirrolilo, furanilo, estando dichos grupos antes citados eventualmente substituidos por uno o varios halógenos y/o por uno o varios grupos:

alquilo- (C_1-C_4),

hidroxilo,

alcoxi- (C_1-C_4),

ciano,

morfolino,

trifluoro-alquilo- (C_1-C_4),

-COR₄,

-SO₂R₄, en el cual R_4 es tal como se define en la reivindicación 1,

-(CH₂)_qNR₅R₆, en el cual R_5 , R_6 y q son tales como se definen en la reivindicación 1,

fenilo,

piridina, y

-SCH₃;

estando el o los átomos de nitrógeno de dichos grupos citados más arriba eventualmente sustituidos por un grupo alquilo-(C₁-C₄),

estando el o los átomos de nitrógeno de dichos grupos citados más arriba eventualmente bajo su forma de N-óxido;

- un grupo quinoxalina, quinolina, isoquinolina, indolo, isoindolo, indolina, indazol, benzotiazol, bencimidazol, benzoxazol, estando dichos grupos antes citados eventualmente sustituidos por uno o varios halógenos y/o por uno o varios grupos hidroxilos, alquilo-(C₁-C₄) o alcoxi-(C₁-C₄);

- m representa 3;

- n representa 1; y

- p representa 0;

en el estado de base o de sal de adición a un ácido farmacéuticamente aceptable, en estado de hidratos o de solvatos, así como en forma de enantiómeros, de diastereoisómeros y su mezcla.

4.- Compuesto según la reivindicación 1, de fórmula (I) en la cual:

- R₁ y R₂ son tales como se definen en la reivindicación 1;

- Y representa un átomo de hidrógeno o un halógeno; y

- R₃ representa:

- un grupo fenilo, substituido por uno o varios átomos de halógeno y/o por uno o varios grupos:

Alquilo-(C₁-C₆),

Alcoxi-(C₁-C₆),

-NO₂,

ciano,

-COR₄,

-SO₂R₄,

-CO₂R₄, en el cual R₄ representa un grupo alquilo-(C₁-C₄),

y

- (CH₂)_qNR₅R₆, en el cual R₅, R₆ y q son tales como se definen en la reivindicación 1;

- un grupo heterocíclico eventualmente substituido por uno o varios halógenos y/o por uno o varios grupos:

alquilo-(C₁-C₄),

hidroxilo,
 alcoxi- (C_1-C_4) ,
 ciano,
 morfolino,
 trifluoro-alquilo- (C_1-C_4) ,
 $-COR_4$,
 $-SO_2R_4$, en el cual R_4 es tal como se define en la reivindicación 1,
 $-(CH_2)_qNR_5R_6$, en el cual R_5 , R_6 y q son tales como se definen en la reivindicación 1,
 fenilo,
 piridina, y
 $-SCH_3$;

estando el o los átomos de nitrógeno del grupo heterocíclico eventualmente substituidos por un grupo alquilo- (C_1-C_4) ,
 estando el o los átomos de nitrógeno del grupo heterocíclico eventualmente bajo su forma de N-óxido;

• un grupo heterobícíclico eventualmente substituido por uno o varios halógenos y/o por uno o varios grupos hidroxilos, alquilo- (C_1-C_4) o alcoxi- (C_1-C_4) ;

- m representa 2 ó 4; y/o
- n representa 0, 1 ó 2; y/o
- p representa 0, 1 ó 2;

en el estado de base o de sal de adición a un ácido farmacéuticamente aceptable, en estado de hidratos o de solvatos, así como en forma de: enantiómeros, de diastereoisómeros y su mezcla.

5.- Compuesto según la reivindicación 1, de fórmula (I) en la cual:

- R_1 y R_2 son tales como se definen en la reivindicación 1;
- Y representa un átomo de hidrógeno o un halógeno; y
- R_3 representa:
 - un grupo fenilo substituido por uno o varios átomos de halógeno y/o por uno o varios grupos:

Alquilo- (C_1-C_6) ,
 Alcoxi- (C_1-C_6) ,
 $-NO_2$,
 ciano,

-COR₄,

-SO₂R₄,

-CO₂R₄, en el cual R₄ representa un grupo alquilo-(C₁-C₄),

y

-(CH₂)_qNR₅R₆, en el cual R₅, R₆ y q son tales como se definen en la reivindicación 1;

• un grupo piridinilo, pirazinilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazolilo, imidazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, oxazolilo, iso-oxazolilo, oxadiazolilo, tiofenilo, pirrolilo, furanilo, estando dichos grupos antes citados eventualmente substituidos por uno o varios halógenos y/o por uno o varios grupos:

alquilo-(C₁-C₄),

hidroxilo,

alcoxi-(C₁-C₄),

ciano,

morfolino,

trifluoro-alquilo-(C₁-C₄),

-COR₄,

-SO₂R₄, en el cual R₄ es tal como se define en la reivindicación 1,

-(CH₂)_qNR₅R₆, en el cual R₅, R₆ y q son tales como se definen en la reivindicación 1,

fenilo,

piridina, y

-SCH₃;

estando el o los átomos de nitrógeno de dichos grupos citados más arriba eventualmente substituidos por un grupo alquilo-(C₁-C₄),

estando el o los átomos de nitrógeno de dichos grupos citados más arriba eventualmente bajo su forma de N-óxido;

• un grupo quinoxalina, quinolina, isoquinolina, indolo, isoindolo, indolina, indazol, benzotiazol, bencimidazol, benzoxazol, estando dichos grupos antes citados eventualmente substituidos por uno o varios halógenos y/o por uno o varios grupos hidroxilos, alquilo-(C₁-C₄) o alcoxi-(C₁-C₄);

- m representa 2 ó 4; y/o

- n representa 0, 1 ó 2; y/o

- p representa 0, 1 ó 2;

en el estado de base o de sal de adición a un ácido farmacéuticamente aceptable, en estado de hidratos o de solvatos, así como bajo forma de enantiómeros, de diastereoisómeros y su mezcla.

6.- Compuesto según la reivindicación 1, de fórmula (I) en la cual:

- R_1 y R_2 son tales como se definen en la reivindicación 1;

- Y representa un átomo de hidrógeno o un halógeno; y

- R_3 representa:

- un grupo fenilo, substituido por uno o varios átomos, de halógeno y/o por uno o varios grupos:

- Alquilo- (C_1-C_6),

- Alcoxi- (C_1-C_6),

- NO_2 ,

- ciano,

- COR_4 ,

- SO_2R_4 ,

- CO_2R_4 , en el cual R_4 representa un grupo alquilo- (C_1-C_4);

y

- $(CH_2)_qNR_5R_6$, en el cual R_5 , R_6 y q son tales como se definen en la reivindicación 1;

- un grupo piridinilo, pirazinilo, pirimidinilo, piridinilo, pirazolilo, imidazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, oxazolilo, iso-oxazolilo, oxadiazolilo, tiofenilo, pirrolilo, furanilo, estando dichos grupos anteriormente citados eventualmente substituidos por uno o varios halógenos y/o por uno o varios grupos:

- alquilo- (C_1-C_4),

- hidroxilo,

- alcoxi- (C_1-C_4),

- ciano,

- morfolino,

- trifluoro-alquilo- (C_1-C_4),

- COR_4 ,

- SO_2R_4 , en el cual R_4 es tal como se define en la reivindicación 1,

- $(CH_2)_qNR_5R_6$, en el cual R_5 , R_6 y q son tales como se definen en la reivindicación 1,

fenilo,
 piridina,
 -SCH₃;

estando el o los átomos de nitrógeno de dichos grupos citados más arriba eventualmente substituidos por un grupo alquilo-(C₁-C₄),

estando el o los átomos de nitrógeno de dichos grupos citados más arriba eventualmente bajo su forma de N-óxido;

- un grupo quinoxalina, quinolina, isoquinolina, indolo, isoindolo, indolina, indazol, benzotiazol, bencimidazol, benzoxazol, estando dichos grupos anteriormente citados eventualmente substituidos por uno o varios halógenos y/o por uno o varios grupos hidroxilos, alquilo-(C₁-C₄) o alcoxi-(C₁-C₄);

- m representa 2 ó 4; y/o
- n representa 0, 1 ó 2; y/o
- p representa 0;

en el estado de base o de sal de adición a un ácido farmacéuticamente aceptable, en estado de hidratos o de solvatos, así como en forma de enantiómeros, de diastereoisómeros y su mezcla.

7.- Compuestos según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, elegidos entre:

- Ácido 1-(1,5-dimetil-1H-pirazol-3-carbonil)-piperidina-3-carboxílico-[4-(5-ciclohexil-2-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-amida

- Ácido 1-(1-metil-1H-imidazol-2-carbonil)-piperidina-3-carboxílico-[4-(5-ciclohexil-2-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-amida,

- Ácido 1-(pirimidina-4-carbonil)-piperidina-3-carboxílico-[4-(5-ciclohexil-2-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-amida,

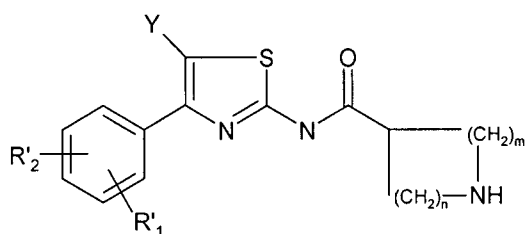
- Ácido 1-(pirazina-2-carbonil)-piperidina-3-carboxílico-[4-(5-ciclohexil-2-etoxifenil)-tiazol-2-il]-amida,

- Ácido 1-(1-oxi-piridina-2-carbonil)-piperidina-3-carboxílico-[4-(5-ciclopentil-2-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-amida,

- Ácido 1-(2-hidroxi-piridina-3-carbonil)-piperidina-3-carboxílico-[4-(5-ciclohexil-2-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-amida,
- Ácido 1-(1-oxi-piridina-3-carbonil)-piperidina-3-carboxílico-[4-(5-ciclohexil-2 metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-amida,
- Ácido 1-(5-cloro-1-metil-1H-pirazol-4-carbonil)-piperidina-3-carboxílico-[4-(5-ciclohexil-2-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-amida,
- Ácido 1-(furan-2-carbonil)-piperidina-3-carboxílico-[4-(5-ciclohexil-2-metoxi fenil)-tiazol-2-il]-amida,
- Ácido 1-(pirazina-2-carbonil)-piperidina-4-carboxílico-[4-(5-ciclohexil-2-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-amida,
- Ácido 1-(pirazina-2-carbonil)-piperidina-2-carboxílico-[4-(5-ciclohexil-2-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-amida,
- Ácido 1-(2-piridin-2-il-acetil)-piperidina-3-carboxílico-[4-(5-ciclohexil-2 metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-amida,
- Ácido 1-(1-oxi-piridina-2-carbonil)-piperidina-3-carboxílico-[4-(5-ciclohexil-2-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-amida,
- Ácido (S)-1-(1-oxi-piridina-2-carbonil)-piperidina-3-carboxílico-[4-(5-ciclohexil-2-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-amida,
- Ácido 1-(pirazina-2-carbonil)-piperidina-3-carboxílico-[4-(5-ciclohexil-2-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-amida,
- Ácido (S)-1-(pirazina-2-carbonil)-piperidina-3-carboxílico-[4-(5-ciclohexil-2-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-amida,
- Ácido 1-(1-oxi-piridina-2-carbonil)-piperidina-3-carboxílico-[4-(5-butiI-2-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-amida,
- Ácido 1-(pirazina-2-carbonil)-piperidina-3-carboxílico-[4-(5-ciclopentil-2- metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-amida,
- Ácido (R)-1-(pirazina-2-carbonil)-piperidina-3-carboxílico-[4-(5-ciclohexil-2- metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-amida,

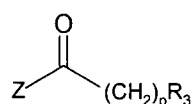
- Ácido 1-(1-oxi-piridina-2-carbonil)-pirrolidina-3-carboxílico-[4-(5-ciclohexil-2-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-amida,
- Ácido (R)-1-(1-oxi-piridina-2-carbonil)-pirrolidina-3-carboxílico-[4-(5-ciclohexil-2-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-amida.

8.- Procedimiento de preparación de un compuesto de fórmula (I) según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, caracterizado porque se hace reaccionar un compuesto de fórmula (V) siguiente:



(V)

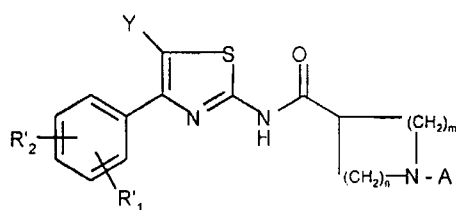
en la cual R'₁ y R'₂ representan precursores de R₁ y de R₂ tales como se definen en la reivindicación 1 e Y, m y n son tales como se definen en la reivindicación 1, con un compuesto de fórmula (VI) siguiente:



(VI)

en la cual Z es un grupo lábil y R₃ y p son tales como se definen en la reivindicación 1, en presencia de un agente de acoplamiento, a una temperatura que varía entre 0°C y 150°C.

9.- Compuesto de fórmula (V'):



(V')

en la cual R'₁ y R'₂ representan precursores de R₁ y de R₂ tales como se definen en la reivindicación 1, Y, m y n son tales como se definen en la reivindicación 1, y A representa un átomo de hidrógeno o un grupo protector - Gp.

10.- Medicamento, caracterizado porque comprende un compuesto de fórmula (I) según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7.

11.- Composición farmacéutica, caracterizada porque comprende un compuesto de fórmula (I) según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, así como al menos un excipiente farmacéuticamente aceptable.

172

NIT : 800176089-2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-043825- -00003-0000

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 7 - 98,205
 FECHA : DICIEMBRE 3 DE 2007

Fecha: 2007-12-13 17:19:51 Dep. 2020 NUECREACION
 No. 11 PALENNIYU Eje. 378 FASENACIONAL
 AL 125 C O D I N F O R M A C I O N Folios. 14

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	48825361	03/12/2007	68,286,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LEAS COMERCIALES	99,000.00
		TOTAL :	\$ 99,000.00

SON: NOVENTA Y NUEVE MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL ASUNTO No.

Colo 14775-841-046-7