

OlarteRaisbeck



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-024646- -00001-0000

Fecha: 2008-05-23 16:24:18 Dep. 2020 NUECREACIONI
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 13

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

P2008/000037

SOLICITUD DE:

1

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Solicitud.

2

SOLICITANTE
(71)

Nombre: PFIZER LIMITED

Dirección: Ramsgate Road, Sandwich, Kent
CT13 9NJ Reino Unido

Nacionalidad o Domicilio: Británica

Lugar de Constitución: Gran Bretaña

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: office@olarteraisbeck.com

IDENTIFICACIÓN

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual _____

Número 79.782.747 Bta
TP 74.295

4

Número de expediente:
08-024.646

5

Descripción de la corrección o modificación solicitada Se incorpora una nueva
Reivindicación 15 que reclama específicamente el compuesto 5-[3-(3-hidroxifenoxi)
azetidin-1-il]-5-metil-2,2-difenilhexamida o una sal o solvato farmacéuticamente acepta-
ble del mismo, el cual se encuentra soportado en el Ejemplo 108 del Capítulo
Descriptivo.

6

Comprobante de pago No. 08-36,175

Fecha Mayo 8 de 2008

7

Anexos

☒

Comprobante de pago de la tasa.

☐

Poderes, si fuere el caso. Documento que soporta la cesión de Derechos.

☐

Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.

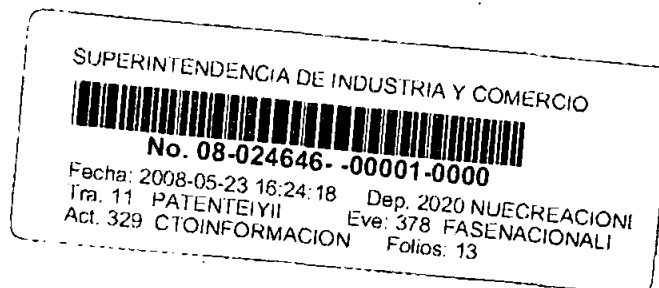
8

NOMBRE: CARLOS R. OLARTE

FIRMA: _____

C.C. 79.782.747 Bta T.P. 74.295

2



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 36.175
FECHA : MAYO 8 DE 2008

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
OLARTE RAISBEK	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	316562	07/05/2008	6,888,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
12		MARCAS Y LEHAS COMERCIALES	103,000.00
		TOTAL :	\$ 103,000.00

SON: CIENTO TRES MIL PESOS

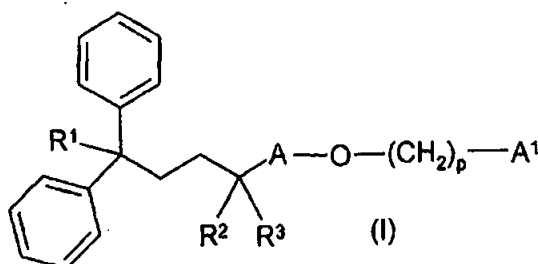
RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

3

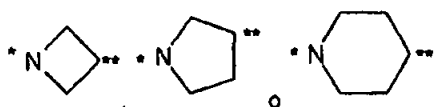
CAPITULO REIVINDICATORIO MODIFICADO

1. Un compuesto de fórmula (I)



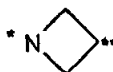
en la que,

- R¹ es CN o CONH₂;
- A se selecciona entre



en la que * y ** representan los puntos de unión, estando ** unido al oxígeno,

- R² y R³ son metilo o cuando A es un grupo de fórmula



R² y R³ también pueden formar junto con el átomo de carbono al que están unidos un anillo de ciclopentano;

- p es 0 ó 1;
- A¹ se selecciona entre

a) fenilo opcionalmente sustituido con 1, 2 ó 3 grupos seleccionados independientemente entre halo, CN, CF₃, OR⁴, SR⁴, OCF₃, alquilo (C₁-C₄) y fenilo opcionalmente sustituido con OH;

M

b) naftilo opcionalmente sustituido con 1 ó 2 grupos seleccionados entre halo, CN, CF₃, OR⁴, SR⁴, OCF₃ y alquilo (C₁-C₄);

c) un grupo heterocíclico aromático bicíclico de 9 ó 10 miembros, que contiene 1, 2 ó 3 heteroátomos seleccionados independientemente entre O, S o N, estando dicho grupo heterocíclico opcionalmente sustituido con 1 ó 2 sustituyentes seleccionados independientemente entre OR⁴, alquilo (C₁-C₄) y halo;

-R⁴ es H o alquilo (C₁-C₄);

o, si es apropiado, las sales o solvatos farmacéuticamente aceptables del mismo.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 en el que R¹ es CONH₂.
3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2 en el que p es 0.
4. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2 en el que p es 1.
5. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4 en el que A¹ es fenilo opcionalmente sustituido con 1, 2 ó 3 grupos, seleccionados independientemente entre F, Cl, CF₃, OH, OCH₃, OCF₃ y CH₃.
6. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 en el que A¹ es fenilo opcionalmente sustituido con 1 ó 2 grupos seleccionados independientemente entre F, Cl, CF₃, OH, OCH₃, OCF₃ y CH₃.
7. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4 en el que A¹ es naftilo opcionalmente sustituido con OH.

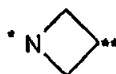
5

8. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4 en el que A¹ se selecciona entre indolilo, isoindolilo, quinolilo, isoquinolilo, benzofuranilo, isobenzofuranilo, benzotienilo, isobenzotienilo, quinazolilo, quinoxalilo, ftalazinilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, bencisotiazolilo, bencisoxazolilo, bencimidazolilo, indazolilo, benzotriazolilo, benzoxadiazolilo, bencisoxadiazolilo, benzotiadiazolilo y bencisotiadiazolilo.

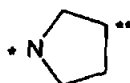
9. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4 en el que A¹ es benzoxazolilo.

10. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 en el que R² y R³ son metilo.

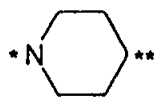
11. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10 en el que A es un grupo de fórmula



12. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10 en el que A es un grupo de fórmula



13. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10 en el que A es un grupo de fórmula



14. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, estando dicho compuesto seleccionado entre:

5-Metil-5-[(3S)-3-fenoxipirrolidin-1-il]-2,2-difenilhexanamida;

5-Metil-5-[(3R)-3-fenoxipirrolidin-1-il]-2,2-difenilhexanamida;

5-[(3S)-3-(3-Hidroxifenoxi)pirrolidin-1-il]-5-metil-2,2-difenilhexanamida;

5-[(3R)-3-(3-Hidroxifenoxi)pirrolidin-1-il]-5-metil-2,2-difenilhexanamida;

amida del ácido 5-[(3S)-3-(3-Fluoro-5-Hidroxi-fenoxi)-pirrolidin-1-il]-5-metil-2,2-difenilhexanoico;

amida del ácido 5-[(3S)-3-(2-Fluoro-3-Hidroxi-fenoxi)-pirrolidin-1-il]-5-metil-2,2-difenilhexanoico;

5-[(3R)-3-(2-Fluoro-3-hidroxi-fenoxi)-pirrolidin-1-il]-5-metil-2,2-difenilhexanamida;

5-[(3R)-3-(2-Cloro-3-hidroxi-fenoxi)-pirrolidin-1-il]-5-metil-2,2-difenilhexanamida;

5-Metil-5-(4-fenoxipiperidin-1-il)-2,2-difenilhexanamida;

5-[4-(3-hidroxifenoxi)piperidin-1-il]-5-metil-2,2-difenilhexanamida;

5-Metil-5-(3-fenoxiazetidin-1-il)-2,2-difenilhexanamida;

5-[3-(3-Hidroxifenoxi)azetidin-1-il]-5-metil-2,2-difenilhexanamida;

5-[3-(4-Cloro-3-hidroxi-fenoxi)-azetidin-1-il]-5-metil-2,2-difenilhexanamida;

5-[3-(3-Fluoro-5-hidroxi-fenoxi)-azetidin-1-il]-5-metil-2,2-difenilhexanamida;

5-{3-(3-Cloro-5-hidroxi-fenoxi)-azetidin-1-il}-5-metil-2,2-difenilhexanamida;

4-{1-[3-(3-Hidroxi-fenoxi)-azetidin-1-il]-ciclopentil}-2,2-difenil-butiramida;

amida del ácido 5-[3-(2-Fluoro-3-hidroxi-fenoxi)-azetidin-1-il]-5-metil-2,2-difenil-hexanoico;

amida del ácido 5-[3-(2-Fluoro-5-hidroxi-fenoxi)-azetidin-1-il]-5-metil-2,2-difenil-hexanoico;

y,

amida del ácido 5-[3-(4-Cloro-3-hidroxi-benciloxi)-azetidin-1-il]-5-metil-2,2-difenil-hexanoico

o, si es apropiado, las sales o solvatos farmacéuticamente aceptables del mismo.

15. Un compuesto acuerdo con la reivindicación 1, que es 5-[3-(3-hidroxifenoxi)azetidin-1-il]-5-metil-2,2-difenilhexanamida o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo.

16. Una composición farmacéutica que comprende al menos una cantidad eficaz de un compuesto de formula (I) como se describe en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 14 o sales o solvatos farmacéuticamente aceptables del mismo.

17. Un compuesto de fórmula (I) como se describe en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 14 o sales o solvatos farmacéuticamente aceptables del mismo, para uso como medicamento.

18. El uso de un compuesto de formula (I) como se describe en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 14 o de sales o solvatos farmacéuticamente aceptables del mismo, para la fabricación de un fármaco que tiene una actividad antagonista del receptor M3.

4

19. El uso de un compuesto de formula (I) como se describe en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 14 o de sales o solvatos farmacéuticamente aceptables del mismo, para la fabricación de un fármaco para el tratamiento de enfermedades, trastornos y afecciones seleccionados entre el grupo constituido por

- 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 constituido por neumonía eosinófila crónica, enfermedad pulmonar obstructiva crónica (COPD), COPD que incluye bronquitis crónica, enfisema pulmonar o disnea asociada o no asociada con COPD, COPD que se caracteriza por una obstrucción irreversible, progresiva de las vías respiratorias, síndrome de insuficiencia respiratoria en adultos (ARDS), exacerbación de la hiperreactividad de las vías respiratorias como consecuencia de otra terapia con fármacos y enfermedad de las vías respiratorias que se asocia con hipertensión pulmonar,

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

- asma de cualquier tipo, etiología o patogénesis, en particular asma que es un miembro seleccionado entre el grupo constituido por asma atópica, asma no atópica, asma alérgica, asma atópica bronquial mediada por IgE, asma bronquial, asma esencial, asma verdadera, asma intrínseca provocada por trastornos patofisiológicos, asma extrínseca provocada por factores medioambientales, asma esencial de causa desconocida o inaparente, asma no atópica, asma bronquítica, asma enfisematosa, asma inducida por el ejercicio, asma inducida por alergenitos, asma inducida por el aire frío, asma ocupacional, asma infecciosa provocada por infección bacteriana, fúngica, protozoaria o viral, asma no alérgica, asma incipiente, síndrome de respiración silbante en niños y bronquiolitis,

- lesión pulmonar aguda,

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

20. Combinación de un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 14 con otro(s) agente(s) terapéutico(s) seleccionado(s) entre:

(a) inhibidores de 5-lipoxigenasa (5-LO) o antagonistas de proteínas que activan 5-lipoxigenasa (FLAP),

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

(c) antagonistas del receptor de histamina incluyendo antagonistas de H1 y H3,

(d) agentes simpaticomiméticos vasoconstrictores con propiedades agonistas de los adrenoceptores α_1 y α_2 para uso descongestivo,

(e) agonistas β_2 de corta o larga actuación,

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

(g) teofilina,

(h) cromoglicato sódico,

(i) inhibidores de COX, inhibidores de COX-1 o COX-2 tanto selectivos como no selectivos (AINE),

(j) glucocorticoesteroides orales e inhalados,

(k) anticuerpos monoclonales activos contra entidades inflamatorias endógenas,

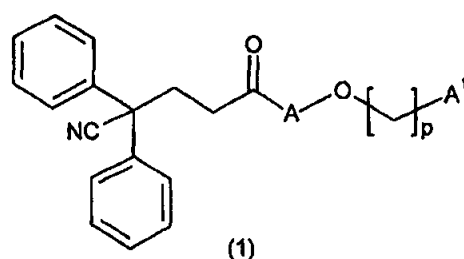
(l) agentes anti factor de necrosis tumoral (anti-TNF- α),

(m) inhibidores de moléculas de adhesión incluyendo antagonistas de VLA-4,

0

- (n) antagonistas del receptor de quinina-B₁ y B₂,
- (o) agentes inmunosupresores,
- (p) inhibidores de metaloproteasas de matriz (MMP),
- (q) antagonistas del receptor 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 receptores de dopamina, por ejemplo, agonistas de D2,
- (v) moduladores de la ruta NFκB, por ejemplo inhibidores de IKK,
- (w) moduladores de las rutas de señalización de citoquina, tales como MAP quinasa p38 o quinasa syk,
- (x) agentes que pueden clasificarse como mucolíticos o anti-tusivos,
- (y) antibióticos,
- (z) inhibidores de HDAC,
- (aa) inhibidores de la quinasa PI3, y,
- (bb) antagonistas de CXCR2.

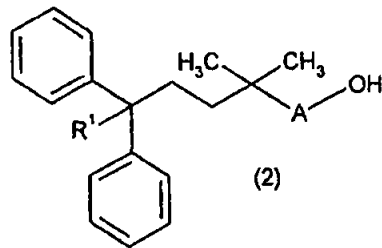
21. Un intermediario de fórmula



en la que A, p y A¹ son como se han definido en la reivindicación 1.

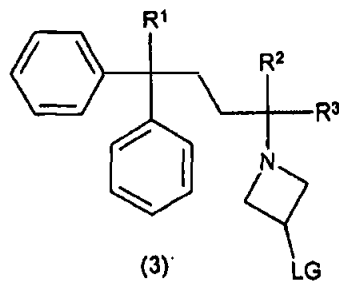
11

22. Un intermediario de fórmula



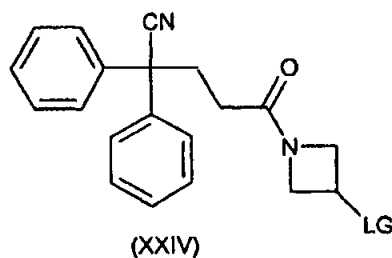
en la que A y R¹ son como se han definido en la reivindicación 1.

23. Un intermediario de fórmula



en la que R¹, R² y R³ son como se han definido en la reivindicación 1 y LG es un grupo saliente adecuado.

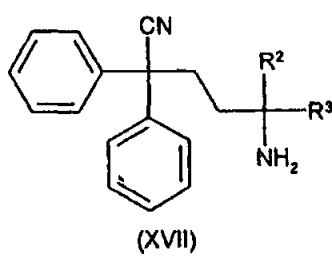
24. Un intermediario de fórmula



en la que LG es un grupo saliente adecuado.

12

25. Un intermediario de fórmula



en la que R² y R³ son como se han definido en la reivindicación 1.

3

ANEXO EXPLICATIVO DE LAS REIVINDICACIONES

Se incorpora una nueva Reivindicación 15 que reclama específicamente el compuesto

5-[3-(3-hidroxifenoxi)azetidin-1-il]-5-metil-2,2-difenilhexanamida o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo, el cual se encuentra soportado en el Ejemplo 108 del Capítulo Descriptivo.