



FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

①

SOLICITUD DE:

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Solicitud.

②

SOLICITANTE

Nombre: **ONO PHARMACEUTICAL CO., LTD**

Dirección: 1-5, Doshomachi 2-chome, Chuo-ku,
Osaka-shi, Osaka, 5418526, Japón.

Nacionalidad o Domicilio: Japón.

Lugar de Constitución: Japón.

Teléfono:

Fax:

E-mail:

IDENTIFICACION

C.C.

☐

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual _____

Número _____

③

**REPRESENTANTE
O APODERADO**

Nombre: **JUAN PABLO CADENA SARMIENTO**

Dirección: Cra. 7 No. 71-21, Torre B, Piso 4

Teléfono: 744-2200

Fax: 742-2200

E-mail:

IDENTIFICACION

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual _____

Número 80 410.337 TP 57492

④ **Número de expediente**

08 095.668

⑤ **Descripción de la corrección o modificación solicitada:** Estamos presentando nuevo capítulo reivindicatorio, donde se han realizado algunas modificaciones, las cuales precisan el objetivo de la solicitud y no afectan en ningún sentido el alcance de la invención.

⑥ **Comprobante de pago No.** 09-28,345

Fecha 30 de junio de 2009

⑦ **Anexos:**

☒ Comprobante de pago de la tasa por \$111.000

☐ Poderes, si fuere el caso.

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

☒ Nuevo capítulo reivindicatorio.

⑧

NOMBRE: JUAN PABLO CADENA SARMIENTO

FIRMA:

C.C. 80.410.337 de Usaquén T.P. 57492 del C.S.J.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-095668- -00002-0000

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 28,345
 FECHA : ABRIL 15 DE 2009

Fecha: 2009-06-30 16:47:55 Dep. 2020 NUECREACIONE
 Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
 Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 11

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
BRIGARD & CASTRO LTDA	RECIBO DE CAJA			28286	15/04/2009	1,648,080.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LEHAS COMERCIALES	111,000.00
		TOTAL :	\$ 111,000.00

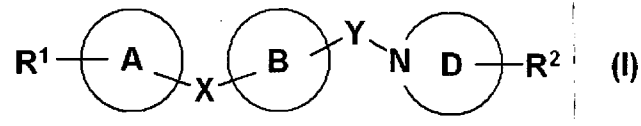
SON: CIENTO ONCE MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.

REIVINDICACIONES

1.Un compuesto representado por la fórmula (I):



en donde R^1 representa (1)- $N(R^{1A})SO_2-R^{1B}$, (2)- $SO_2NR^{1C}R^{1D}$, (3)- $COOR^{1E}$, (4) - OR^{1F} , (5) - $S(O)_mR^{1G}$, (6) - $CONR^{1H}R^{1J}$, (7) - $NR^{1K}COR^{1L}$, (8) un grupo ciano, (9) un grupo nitro, (10) - $NR^{1M}R^{1N}$, (11) - $N(R^{1P})SO_2NR^{1Q}R^{1R}$, (12) - $N(R^{1S})SO_2N(R^{1T})COOR^{1U}$, (13) - $N(R^{1AA})C(=O)NR^{1BB}R^{1CC}$, (14) - $N(R^{1DD})C(=S)NR^{1EE}R^{1FF}$, (15) - COR^{1GG} , (16) - $c(R^{1HH}R^{1JJ})OR^{1KK}$, (17) - $C(R^{1LL}R^{1MM})N(R^{1NN})SO_2-R^{1PP}$, (18) - $C(R^{1QQ}R^{1RR})SO_2NR^{1SS}R^{1TT}$, (19) - $C(R^{1AAA}R^{1BBB})S(O)_mR^{1CCC}$, ó (20) un grupo heterocíclico de 3 a 15 miembros, que puede tener un radical(es);

en donde m es 0, 1 ó 2;

$R^{1A}, R^{1B}, R^{1C}, R^{1D}, R^{1E}, R^{1F}, R^{1G}, R^{1H}, R^{1J}, R^{1K}, R^{1L}, R^{1M}, R^{1N}, R^{1P}, R^{1Q}, R^{1R}, R^{1S}, R^{1T}, R^{1U}, R^{1AA}, R^{1BB}, R^{1CC}, R^{1DD}, R^{1EE}, R^{1FF}, R^{1GG}, R^{1HH}, R^{1JJ}, R^{1KK}, R^{1LL}, R^{1MM}, R^{1NN}, R^{1PP}, R^{1QQ}, R^{1RR}, R^{1SS}, R^{1TT}, R^{1AAA}, R^{1BBB}$ y R^{1CCC} , cada uno independientemente representa un átomo de hidrógeno, un grupo hidrocarburo que puede tener un radical(es), o un grupo heterocíclico de 3 a 15 miembros, que puede tener un radical(es), siempre y cuando R^{1C} y R^{1D} , R^{1H} y R^{1J} , R^{1M} y R^{1N} , R^{1Q} y R^{1R} , R^{1BB} y R^{1CC} , R^{1EE} y R^{1FF} , o R^{1SS} y R^{1TT} puedan formar un grupo heterocíclico con componente de nitrógeno, que puede tener un radical(es), junto con un átomo de nitrógeno, al cual se unen, y R^{1HH} y R^{1JJ} , R^{1LL} y R^{1MM} , R^{1QQ} y R^{1RR} , o R^{1AAA} y R^{1BBB} puedan formar un grupo carbocíclico, que puede tener un radical(es), junto con un átomo de carbono, al cual se unen;

X y Y cada uno independientemente representa un enlace o un espaciador que contiene 1 ó 3 átomos como cadena principal;

anillo A y anillo B pueden ser los mismos o diferentes y representar un grupo heterocíclico o carbocíclico, de 3 a 15 miembros, el cual puede tener

un radical(es) adicional(es);

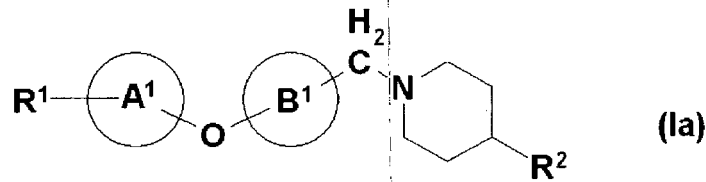
anillo D representa un grupo heterocíclico con componente de nitrógeno, de 3 a 15 miembros, el cual puede tener un radical(es) adicional(es); y

R² representa (1) un átomo de hidrógeno, (2) un grupo hidrocarburo que puede tener un radical(es), (3) un grupo ciano, (4) un grupo hidroxilo, el cual puede protegerse, (5) un grupo amino, que puede tener un radical(es), (6) un grupo oxo, (7) un grupo heterocíclico de 3 a 15 miembros, que puede tener un radical(es), o (8) =N-OR⁶;

en donde R⁶ representa un átomo de hidrógeno o un grupo C₁₋₄ alquilo,

siempre y cuando R¹ y un radical de anillo A puedan formar un anillo que puede tener un radical(es);
una sal, un N-óxido, un solvato o profármaco del mismo;

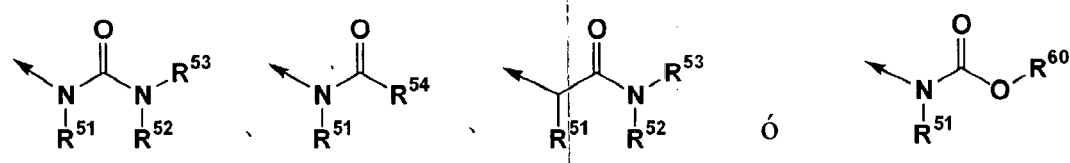
2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, que se representa por fórmula (Ia):



en donde anillo A¹ y anillo B¹ pueden ser los mismos o diferentes y representar un anillo benceno o piridina, el cual puede tener un radical(es) adicional(es); y los demás símbolos tienen el mismo significado anteriormente especificado en el numeral ya descrito 1, siempre y cuando R no represente un grupo oxo, o =N-OR⁶,

en donde R⁶ representa un átomo de hidrógeno o un grupo C₁₋₄ alquilo, una sal, un N-óxido, un solvato o profármaco del mismo;

3. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 2, en donde R² es:



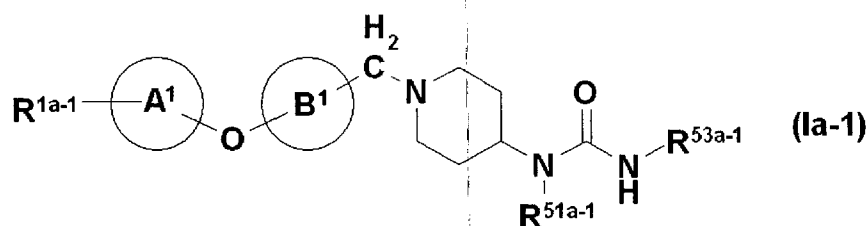
en donde la flecha representa una posición de unión al anillo piperidina; R^{51} , R^{52} , R^{53} y R^{54} , cada uno independientemente representa (1) un átomo de hidrógeno, (2) un grupo hidrocarburo, que puede tener un radical(es), (3) un grupo heterocíclico de 3 a 15 miembros, que puede tener un radical(es), (4) un grupo C_{1-4} alcoxi, que puede tener un radical(es), (5) un grupo fenoxi, que puede tener un radical(es), o (6) un grupo benciloxi, que puede tener un radical(es); y R^{60} representa (1) un átomo de hidrógeno, (2) un grupo hidrocarburo, que puede tener un radical(es), o (3) un grupo heterocíclico de 3 a 15 miembros, que puede tener un radical(es), una sal, un N-óxido, un solvato o profármaco del mismo;

4. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 3, en donde R^{51} , R^{53} , R^{54} y R^{60} , cada uno independientemente representa (1) un anillo benceno, que puede tener un radical(es), (2) un anillo piridina, que puede tener un radical(es), o (3) un grupo bencilo, que puede tener un radical(es); y R^{52} es un átomo de hidrógeno, una sal, un N-óxido, un solvato o profármaco del mismo;

5. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, en donde el radical es un átomo de halógeno o un grupo C_{1-4} alquilo, que puede tener un radical(es), una sal, un N-óxido, un solvato o profármaco del mismo;

6. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, en donde el radical es un átomo de flúor, un átomo de cloro, un grupo metilo, o un grupo trifluorometilo, una sal, un N-óxido, un solvato o profármaco del mismo;

7. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 3, que se representa por fórmula (Ia-1):



en donde R^{1a-1} representa $-CONR^{1H}R^{1J}$ ó $-COR^{1GG}$, en donde todos los símbolos tienen los mismos significados indicados anteriormente en el

numeral ya descrito 1; R^{51a-1} representa un grupo hidrocarburo, que puede tener un radical(es); R^{53a-1} representa (1) un anillo benceno, que puede tener un radical(es) o (2) un anillo piridina, que puede tener un radical(es); y los demás símbolos tienen los mismos significados indicados anteriormente en el numeral ya descrito 2,

una sal, un N-óxido, un solvato o profármaco del mismo;

8. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 7, en donde R^{1GG} es un grupo heterocíclico de 3 a 15 miembros, que puede tener un radical(es), una sal, un N-óxido, un solvato o profármaco del mismo;

9. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 8, en donde R^{1GG} es un grupo heterocíclico saturado con componente de nitrógeno, de 3 a 8 miembros, que puede tener un radical(es), una sal, un N-óxido, un solvato o profármaco del mismo;

10. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 9, en donde grupo heterocíclico saturado con componente de nitrógeno, de 3 a 8 miembros es un anillo piperidina, piperazina o morfolina, una sal, un N-óxido, un solvato o profármaco del mismo;

11. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 7, el cual es

N-(3-fluorofenil)-N'-{1-[(6-{4-[(4-metil-1-piperazinil)sulfonil] fenoxi}-3-piridinil)metil]-4-piperidinil}-N'-(6-metil-3-piridinil) urea,

4-[(5-{[4-((3-fluorofenil){[(6-metil-3-piridinil)amino]carbonil} amino)-1-piperidinil]metil}-2-piridinil)oxi]-N-(2-metoxietil) bencenosulfonamida,

N-(3-fluorofenil)-N'-(6-metil-3-piridinil)-N-[1-[(6-{4-(4-morfolinilsulfonil)fenoxi}-3-piridinil)metil]-4-piperidinil]urea,

N-(3-fluorofenil)-N'-(6-metil-3-piridinil)-N-{1-[(6-{4-[(4-oxo-1-piperidinil)sulfonil]fenoxi}-3-piridinil)metil]-4-piperidinil}urea,

N-(3-fluorofenil)-N'-{1-[(6-{4-[(4-hidroxi-1-piperidinil)sulfonil] fenoxi}-3-piridinil)metil]-4-piperidinil}-N'-(6-metil-3-piridinil) urea,

N-{1-[(6-{4-[(aminosulfonil)amino]fenoxi}-3-piridinil)metil]-4-piperidinil}-N-(3-fluorofenil)-N'-(6-metil-3-piridinil)urea,

4-[(5-{[4-((3-fluorofenil){[(6-metil-3-piridinil)amino]carbonil} amino)-1-piperidinil]metil}-2-piridinil)oxi]-N-(2-hidroxietil) bencenosulfonamida,

N-(3-fluorofenil)-N-[1-({6-[4-(6-metil-1,1-dióxido-1,2,6-tiadiazinan-2-il)fenoxi]-3-piridinil]metil}-4-piperidinil)-N'-(6-metil-3-piridinil)urea,

4-[(5-{[4-((3-fluorofenil){[(6-metil-3-piridinil)amino]carbonil} amino)-1-piperidinil]metil}-2-piridinil)oxi]-N-(2-hidroxi-2-metilpropil) bencenosulfonamida,

4-[(5-{[4-((3-fluorofenil){[(6-metil-3-piridinil)amino]carbonil} amino)-1-piperidinil]metil}-2-piridinil)oxi]-N-(3-metoxipropil) bencenosulfonamida,

N-{4-[(5-{[4-((3-fluorofenil){[(6-metil-3-piridinil)amino]carbonil} amino)-1-piperidinil]metil}-2-piridinil)oxi]fenil} ciclopropanosulfonamida, o

4-[(5-{[4-((3-fluorofenil){[(6-metil-3-piridinil)amino]carbonil} amino)-1-piperidinil]metil}-2-piridinil)oxi]-N-(3-hidroxi-3-metilbutil) bencenosulfonamida, una sal, un N-óxido, un solvato o profármaco del mismo;

12. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 7, el cual es

5-[(1-{[6-(4-acetilfenoxi)-2-metil-3-piridinil]metil}-4-piperidinil) (butil)carbamoil]amino)-2,4-difluorobenzamida,

5-({butil[1-({2-metil-6-[4-(metilcarbamoil)fenoxi]-3-piridinil} metil)-4-piperidinil]carbamoil]amino)-2,4-difluorobenzamida,

5-[(1-{[6-(4-{[4-acetil-1-piperazinil]carbonil}fenoxi)-2-metil-3-piridinil]metil}-4-piperidinil)(butil)carbamoil]amino)-2,4-difluorobenzamida,

5-({butil[1-({6-[4-(dimetilcarbamoil)fenoxi]-2-metil-3-piridinil} metil)-4-piperidinil]carbamoil]amino)-2,4-difluorobenzamida,

5-({butil[1-({6-[4-(etilcarbamoil)fenoxi]-2-metil-3-piridinil]metil)-4-piperidinil]carbamoil]amino)-2,4-difluorobenzamida,

5-[(butil{1-[(2-metil-6-{4-[4-(4-metil-1-piperazinil)carbonil}fenoxi)-3-piridinil]metil}-4-piperidinil}carbamoil]amino)-2,4-difluorobenzamida,

5-[(butil{1-[(6-{4-[4-(4-hidroxi-1-piperidinil)carbonil}fenoxi)-2-metil-3-piridinil]metil}-4-piperidinil}carbamoil]amino)-2,4-difluorobenzamida,

5-({butil[1-({2-metil-6-[4-(4-morfolinilcarbonil)fenoxi]-3-piridinil} metil)-4-piperidinil]carbamoil]amino)-2,4-difluorobenzamida,

5-[(butil(1-{[2-metil-6-(4-{[4-(trifluorometil)-1-piperidinil] carbonil}fenoxi)-3-piridinil]metil}-4-piperidinil)carbamoil]amino)-2,4-difluorobenzamida,

5-[(1-{[6-(4-{[4-acetil-1-piperazinil]carbonil}fenoxi)-2-metil-3-piridinil]metil}-4-piperidinil)(propil)carbamoil]amino)-2,4-difluorobenzamida, o

5-[(1-{[6-(4-{[4-acetil-1-piperazinil]carbonil}fenoxi)-2-metil-3-

piridinil)metil]-4-piperidinil}(2-buten-1-il)carbamoil]amino}-2,4-difluorobenzamida,
una sal, un N-óxido, un solvato o profármaco del mismo;

13. Una composición farmacéutica que contiene el compuesto presentado por fórmula (I), de acuerdo con la reivindicación 1, una sal, un N-óxido, un solvato o profármaco del mismo;

14. La composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 13, que es un antagonista del receptor de quimiocina;

15. La composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 14, que es un antagonista de CCR5;

16. La composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 15, que es un agente para la prevención y/o tratamiento de enfermedades relacionadas con CCR5;

17. La composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 16, en donde las enfermedades relacionadas con CCR5 son enfermedades infecciosas, enfermedades inmunológicas, enfermedades inflamatorias y/o enfermedades cardiovasculares;

18. La composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 16, en donde las enfermedades relacionadas con CCR5 son infección con el virus de la inmunodeficiencia humana, el síndrome de la inmunodeficiencia adquirida, la infección con el virus sincicial respiratorio, rechazo en trasplante de órganos, esclerosis múltiple, enfermedad intestinal inflamatoria, y/o asma;

19. Un medicamento que comprende una combinación del compuesto presentado por fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, una sal, N-óxido, un solvato, o un profármaco del mismo, y uno o más agente(s) seleccionado de un inhibidor de transcriptasa inversa, un inhibidor de proteasa, un inhibidor de integrasa, un antagonista de CCR2, un antagonista de CCR3, un antagonista de CCR4, un antagonista de CCR5, un antagonista

9

de CXCR3, un antagonista de CXCR4, un inhibidor de fusión, un anticuerpo contra un antígeno de superficie de VIH, y una vacuna de VIH, un agente inmunosupresor, un medicamento antiinflamatorio no esteroideo, un medicamento anti-reumático modificador, esteroides, una preparación enzimática antiinflamatoria, un agente condroprotector, un inhibidor de linfocitos T, un inhibidor de $TNF\alpha$, un inhibidor de prostaglandina sintasa, un inhibidor de IL-1, un inhibidor de IL-6, un agonista de interferón gamma, prostaglandina, un inhibidor de fosfodiesterasa y un inhibidor de metaloproteinasa;

20. Un método para prevenir o tratar una enfermedad relacionada con CCR5 en un mamífero, que comprende administrar a un mamífero una cantidad efectiva del compuesto presentado por fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, una sal, N-óxido, un solvato, o un profármaco del mismo;

21. Uso del compuesto presentado por fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, una sal, N-óxido, un solvato, o un profármaco del mismo, para la fabricación de un agente para la prevención y/o tratamiento de una enfermedad relacionada con CCR5.

22. Un compuesto seleccionado del grupo que consiste en:

(1) 5-({butil[1-({2-metil-6-[4-(metilsulfonil)fenoxi]-3-piridinil}metil)-4-piperidinil]carbamoil}amino)-2,4-difluorobenzamida

(2) 5-{{butil(1-{{2-metil-6-(4-{{4-(trifluorometil)-1-piperidinil}sulfonil}}fenoxi)-3-piridinil}metil)-4-piperidinil}carbamoil} amino}-2,4-difluorobenzamida

(3) 5-({butil[1-({6-[4-(etilcarbamoil)fenoxi]-2-metil-3-piridinil}metil)-4-piperidinil]carbamoil}amino)-2,4-difluorobenzamida

(4) 5-[(butil{1-[(2-metil-6-{4-[(metilsulfonil)metil]fenoxi}-3-piridinil}metil)-4-piperidinil]carbamoil}amino)-2,4-difluorobenzamida

(5) 5-[(2-butin-1-il{1-[(2-metil-6-{4-[(metilsulfonil)amino]fenoxi}-3-

piridinil)metil]-4-piperidinil}carbamoil)amino]-2,4-difluorobenzamida

(6) 5-[(butil{1-[(2-etil-6-{4-[(metilsulfonil)amino]fenoxi}-3-piridinil)metil]-4-piperidinil}carbamoil)amino]-2,4-difluorobenzamida

(7) 5-[(butil{1-[(2-isopropil-6-{4-[(metilsulfonil)amino]fenoxi}-3-piridinil)metil]-4-piperidinil}carbamoil)amino]-2,4-difluorobenzamida

(8) 5-[(butil{1-[(6-{4-[(4-hidroxi-1-piperidinil)carbonil]fenoxi}-2-metil-3-piridinil)metil]-4-piperidinil}carbamoil)amino]-2,4-difluorobenzamida; y

(9) 5-[(butil{1-[(2-isopropil-6-{4-[(metilsulfonil)fenoxi]-3-piridinil)metil]-4-piperidinil}carbamoil)amino]-2,4-difluorobenzamida,

una sal o un solvato del mismo.

23. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste en:

(1) 5-[(butil{1-[(2-metil-6-{4-[(metilsulfonil)fenoxi]-3-piridinil)metil]-4-piperidinil}carbamoil)amino]-2,4-difluorobenzamida

(2) 5-[(butil{1-[(2-metil-6-{4-[(trifluorometil)-1-piperidinil]sulfonil}fenoxi)-3-piridinil]metil]-4-piperidinil}carbamoil)amino]-2,4-difluorobenzamida

(3) 5-[(butil{1-[(6-{4-(etilcarbamoil)fenoxi}-2-metil-3-piridinil)metil]-4-piperidinil}carbamoil)amino]-2,4-difluorobenzamida

(4) 5-[(butil{1-[(2-metil-6-{4-[(metilsulfonil)metil]fenoxi}-3-piridinil)metil]-4-piperidinil}carbamoil)amino]-2,4-difluorobenzamida

(5) 5-[(2-butin-1-il{1-[(2-metil-6-{4-[(metilsulfonil)amino]fenoxi}-3-piridinil)metil]-4-piperidinil}carbamoil)amino]-2,4-difluorobenzamida

(6) 5-[(butil{1-[(2-etil-6-{4-[(metilsulfonil)amino]fenoxi}-3-piridinil)metil]-4-

piperidinil}carbamoil)amino]-2,4-difluorobenzamida

(7) 5-[(butil{1-[(2-isopropil-6-{4-[(metilsulfonil)amino]fenoxi}-3-piridinil)metil]-4-piperidinil}carbamoil)amino]-2,4-difluorobenzamida

(8) 5-[(butil{1-[(6-{4-[(4-hidroxi-1-piperidinil)carbonil]fenoxi}-2-metil-3-piridinil)metil]-4-piperidinil}carbamoil)amino]-2,4-difluorobenzamida; y

(9) 5-({butil[1-({2-isopropil-6-[4-(metilsulfonil)fenoxi]-3-piridinil}metil)-4-piperidinil]carbamoil)amino)-2,4-difluorobenzamida,

una sal o un solvato del mismo.