

RAISBECK, LARA, RODRÍGUEZ & RUEDA
MIEMBROS DE LA FIRMA
BAKER & MCKENZIE

AVENIDA 82 N° 10 - 62, Piso 6
TELÉFONO: (57-1) 6341500
BOGOTÁ, D.C. COLOMBIA
WWW.BAKERINFO.COM
OFFICE.BOGOTA@BAKERNET.COM

231
278

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Radicación : 00063870 00000003 Folios: 2
Fecha (iMB): 2002-08-13 16:40:12
Trámite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 538 PETICION
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

Ref.: Expediente No. **00.063.870.**

Solicitud de Patente de Invención Titulada:

“UNA COMPOSICION FARMACEUTICA PARA
TRATAR LA DEPENDENCIA O ADICCION A LA
NICOTINA, QUE COMPRENDE UN AGONISTA
PARCIAL DEL RECEPTOR NICOTÍNICO Y UN
AGENTE ANTIDEPRESIVO O ANSIOLITICO”.

Solicitante: **PFIZER PRODUCTS INC.**

**SOLICITUD DE EXAMEN DE FONDO SEGÚN EL ARTICULO 44 DE LA
DECISION 486, GACETA No. 518**

CARLOS R. OLARTE, mayor de edad y vecino de Bogotá, D.C., identificado según aparece al pie de mi firma, en mi condición de apoderado del solicitante, respetuosamente me permito solicitar, dando cumplimiento a lo establecido en el artículo 44 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina de Naciones, que se examine si la invención reúne los requisitos de patentabilidad previstos en la misma. Adjunto recibo por el monto de \$ 318.000 pesos para cubrir la tasa correspondiente, según la Resolución 44691 del año 2001.

Atentamente,



CARLOS R. OLARTE
C.C. No. 79'782.747 de Bogotá
T.P. 74.295

Anexos: Recibo por \$ 318.000 pesos
FTT/P2000-000123 090802.DOC

232 739

NIT : 800176089-2

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO		Folios: 2
Radicacion : 00063670 00000003		
Fecha (AMD): 2002-08-13 16:40:12		
Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 538 PETICION		
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES		

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 02 - 41,120
FECHA : JUNIO 24 DE 2002

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
JORGE LUIS GOMEZ	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	4317419	24/06/2002	39,418,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-01 SOLICITUDES	85 EXAMEN DE PATENTABILIDAD DE INVEN	318,000.00
	TOTAL :	\$ 318,000.00

SON: TRESCIENTOS DIEZ Y OCHO MIL PESOS

RESPONDE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

233 200

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES**

2020/
Bogotá, D.C.,

**Doctor
Carlos R. Olarte
Apoderado**

Oficio N° 9917

REFERENCIA	Radicación	00 63870
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Folios	008

Como resultado del examen de patentabilidad de la solicitud de patente de invención N° 00 63870, realizado según el artículo 45 de la decisión 486 de la comisión de la Comunidad Andina, se notifica:

Documentos estudiados:

- . Descripción: folios 146-181
- . Ejemplos: folios 181-199
- . Capítulo reivindicatorio estudiado: folios 200-217
- . Se reivindica prioridad, presentada en Estados Unidos el 27.08.99, bajo el número 60/151089

Objeto de la invención

Según las reivindicaciones 1 a 13 de la presente solicitud, se refiere a composiciones farmacéuticas para el tratamiento de la dependencia o la adicción a la nicotina que comprende una combinación de un agonista parcial de receptor nicotínico y un anti depresivo o ansiolítico, y un vehículo farmacéuticamente aceptable

Clasificación internacional de patentes A 61 K 31/435

234 741

Claridad de la solicitud

El artículo 30 de la decisión 486 contempla que *"Las reivindicaciones definirán la materia que se desea proteger mediante la patente. Deben ser claras y concisas y estar enteramente sustentadas por la descripción"*

El presente capítulo reivindicatorio se relaciona con compuestos que se definen por sus características deseables o propiedades farmacológicas tales como "agonista parcial del receptor nicotínico", "antidepresivo", "ansiolítico", "antidepresivo tricíclico", "SRI", antidepresivo atípico", "inhibidor de la monoamina oxidasa", "benzodiacepina", "ansiolítico no benzodiacepínico", y por lo tanto estos términos abarcan una gran cantidad de compuestos que incluso no se encuentran en la descripción.

Favor hacer las aclaraciones y correcciones del caso.

Excepciones a la patentabilidad

El art. 20d de la decisión 486 contempla que *"No serán patentables los métodos terapéuticos o quirúrgicos para el tratamiento humano o animal, así como los métodos de diagnóstico aplicados a los seres humanos o a animales"*

Teniendo en cuenta lo anterior, el contenido de las reivindicaciones 7-13 que tratan de "un procedimiento para tratar un mamífero...", no es patentable.

Determinación del estado de la técnica:

Consultadas las fuentes de información con que cuenta este despacho, se encontraron los siguientes documentos, anteriores a la fecha de prioridad de la presente solicitud - 27.08.99-, relacionados con la materia de la presente solicitud:

Nº	Documento	Título	Fecha de Publicación
1	WO 9818798	"Derivados de azabicyclos fusionados con piridona o citisina, su preparación y uso en terapia de adicción"	07.05.98
2	WO 9935131	"Compuestos de arilo fusionados con azapoliciclos"	15.07.99

Evaluación de los requisitos de patentabilidad:

El artículo 14 de la decisión 486 de la comisión de la comunidad andina establece que: *"Los países miembros otorgarán patentes para las invenciones, sean de producto o de procedimiento, en todos los campos de la tecnología, siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial"*

En cumplimiento del artículo 14 de la decisión 486 de la comisión de la comunidad andina, se procedió a evaluar los requisitos de novedad, nivel inventivo y aplicación industrial con el fin de establecer la patentabilidad de la invención reivindicada en la solicitud en estudio.

235 797

Evaluación de la NOVEDAD

El art. 16 de la decisión 486 establece que *"Una invención se considerará nueva cuando no está comprendida en el estado de la técnica"*

Las publicaciones WO 9818798 y WO 9935131 revelan compuestos agonistas parciales del receptor nicotínico y en su descripción enseñan composiciones de dichos compuestos con antidepresivos.

Comparando elemento por elemento, las composiciones de las reivindicaciones 1-3 son iguales a las de los documentos citados y pueden afectar la novedad de la presente solicitud

Evaluación del NIVEL INVENTIVO

El artículo 18 de la decisión 486 dispone *"Se considerará que una invención tiene nivel inventivo, si para una persona del oficio normalmente versada en la Materia técnica correspondiente, esa invención no hubiese resultado obvia ni se hubiese derivado de manera evidente del estado de la técnica"*

Las publicaciones WO 9818798 y WO 9935131 revelan compuestos agonistas parciales del receptor nicotínico y en su descripción enseñan composiciones de dichos compuestos con antidepresivos.

Teniendo en cuenta el objeto de la solicitud, el cual es proporcionar composiciones para el tratamiento de la adicción a la nicotina que comprenden una agonista parcial del receptor nicotínico y un antidepresivo, se observa que es una derivación del estado de la técnica, ya que los documentos citados enseñan composiciones similares que tienen el mismo propósito, afectando el nivel inventivo de las reivindicaciones 4-6

Un técnico con sus conocimientos y combinando los documentos citados llegaría de manera evidente a las composiciones que se pretenden proteger.

Finalmente no se demuestran ventajas sorprendentes de las composiciones de la presente solicitud en comparación con las del estado de la técnica.

Lo anterior hace que los documentos citados puedan afectar el nivel inventivo de la presente solicitud.

En conclusión los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

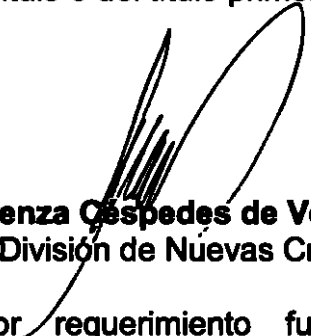
Nº	Documento	Reivindicaciones Afectadas	Requisito que afecta
1	WO 9818798	1-3	Novedad
		4-6	Nivel Inventivo
2	WO 9935131	1-3	Novedad
		4-6	Nivel Inventivo

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de

236 243

sesenta días contados a partir de la fecha de la notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo 5 del título primero de la Circular Única N° 10 de 2001


Álix Carmenza Céspedes de Vergel
Jefe de la División de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 27 OCT. 2005

CONCEPTO TÉCNICO Número 1636	EXAMINADOR TÉCNICO Código 202024
--	--

240P
237

PCT

WORLD INTELLECTUAL PROPERTY ORGANIZATION
International Bureau



INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(51) International Patent Classification ⁶ : C07D 471/18, A61K 31/44, 31/445, 31/455 // (C07D 471/18, 221:00, 221:00, 221:00)		A1	(11) International Publication Number: WO 98/18798
			(43) International Publication Date: 7 May 1998 (07.05.98)
(21) International Application Number: PCT/IB97/01282		(81) Designated States: AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GE, HU, IL, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ARIPO patent (GH, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), Eurasian patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG).	
(22) International Filing Date: 15 October 1997 (15.10.97)		Published <i>With international search report.</i>	
(30) Priority Data: 60/028,804 30 October 1996 (30.10.96) US			
(71) Applicant (for all designated States except US): PFIZER INC. [US/US]; 235 East 42nd Street, New York, NY 10017 (US).			
(72) Inventor; and (75) Inventor/Applicant (for US only): O'NEILL, Brian, Thomas [US/US]; 18 Clapboard Hill Road, Old Saybrook, CT 06475 (US).			
(74) Agents: SPIEGEL, Allen, J. et al.; Pfizer Inc., 235 East 42nd Street, New York, NY 10017 (US).			
(54) Title: PYRIDONE-FUSED AZABICYCLIC- OR CYTISINE DERIVATIVES, THEIR PREPARATION AND THEIR USE IN ADDICTION THERAPY			
(57) Abstract			
Pyridone-fused azabicyclic compounds of formula (I), and their pharmaceutically acceptable salts and prodrugs, wherein R¹, R² and R³ are defined below, intermediates and methods for their preparation. Compositions and methods for using compounds of formula (I) in the treatment of neurological and mental disorders related to a decrease in cholinergic function such as nicotine addiction, Huntington's Chorea, tardive dyskinesia, hyperkinesia, mania, dyslexia, schizophrenia, analgesia, attention deficit disorder (ADD), multi-infarct dementia, age related cognitive decline, epilepsy, neurological and mental disorders related to a decrease in cholinergic function, senile dementia of the Alzheimer's type, Parkinson's disease, attention deficit hyperactivity disorder (ADHD), anxiety, obesity, Tourette's Syndrome and ulcerative colitis.		(I)	

PYRIDONE-FUSED AZABICYCLIC- OR CYTISINE DERIVATIVES, THEIR PREPARATION AND THEIR USE IN ADDICTION THERAPY

Background of the Invention

This invention relates to azabicyclic compounds. More particularly it relates to pyridone-fused azabicyclic compounds of the formula I below. Compounds of formula I are useful in the treatment of addictive disorders such as the use of tobacco or other nicotine containing products and also for the treatment or prevention of withdrawal symptoms caused by cessation of chronic or long term use of tobacco products. These compounds are also useful in the treatment of Huntington's Chorea, tardive dyskinesia, hyperkinesia, mania, dyslexia, schizophrenia, analgesia, attention deficit disorder (ADD), multi-infarct demetia, age related cognitive decline, epilepsy, neurological and mental disorders related to a decrease in cholinergic function such as Huntington's Chorea, tardive dyskinesia, hyperkinesia, mania, dyslexia, schizophrenia, analgesia, attention deficit disorder (ADD), multi-infarct demetia, age related cognitive decline, epilepsy, neurological and mental disorders related to a decrease in cholinergic function, senile dementia of the Alzheimer's type, Parkinson's disease, attention deficit hyperactivity disorder (ADHD), anxiety, obesity, Tourette's Syndrome and ulcerative colitis.

The compounds of this invention may also be used in combination with a anti-depressants such as imipramine in order to treat both the cognitive decline and depression associated with AD; in combination with serotonin uptake inhibitors such as Zoloft to treat both the cognitive decline and depression associated with AD; in combination with muscarinic agonists in order to stimulate both central muscarinic and nicotinic receptors; in combination with neurotrophic factors such as NGF in order to maximize cholinergic enhancement; in combination with agents which slow or arrest AD such as amyloid or tau inhibitors.

Substances which can deliver pharmacologically relevant amounts of nicotine to the central nervous system are among the most abused substances known. These include, but not are not limited to tobacco cigarettes, and "chewing tobacco" (see J. E. Henningfield, Ph.D, New England Journal of Med., 1196, 1995). Cigarette smoking has been tied to increased risk for lung cancer, emphysema and heart disease and it is estimated 400,000 people will die in 1995 from the combined effects of nicotine abuse in the United States (see J. A. Califano, Jr., New England Journal of Med. 1214, 1995). Nicotine is a highly addicting drug with 40% of those who try smoking later becoming physically dependent upon it. Attempts to quit the use of nicotine, such as in smoking, have been largely ineffective with > 80 % of such attempts ending in failure. Most attempts to quit end in failure in the first week due to intense withdrawal and craving symptoms. An effective therapy should aid in the cessation or lessening of tobacco use, prevent withdrawal.etc prevent withdrawal symptoms, relieve craving and, simultaneously, antagonize the reinforcing effects of nicotine obtained through smoking. Currently, few therapies are available for smoking cessation and most involve replacement of cigarettes with nicotine in the form of a patch

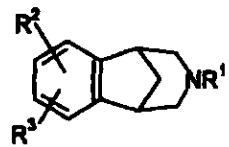
246
239



PCT

WORLD INTELLECTUAL PROPERTY ORGANIZATION
International Bureau

INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(51) International Patent Classification ⁶ : C07D 221/22, A61K 31/435, C07D 471/08, 498/08, 513/08		A1	(11) International Publication Number: WO 99/35131 (43) International Publication Date: 15 July 1999 (15.07.99)
(21) International Application Number: PCT/IB98/01813 (22) International Filing Date: 13 November 1998 (13.11.98) (30) Priority Data: 60/070,245 31 December 1997 (31.12.97) US (71) Applicant (for all designated States except US): PFIZER PRODUCTS INC. [US/US]; Eastern Point Road, Groton, CT 06340 (US). (72) Inventors; and (75) Inventors/Applicants (for US only): COE, Jotham, Wadsworth [US/US]; 8 Bush Hill Drive, Niantic, CT 06357 (US). BROOKS, Paige, Roanne, Palmer [US/US]; 9 Wyassup Road, North Stonington, CT 06359 (US). (74) Agents: SPIEGEL, Allen, J. et al.; Pfizer Inc., 235 East 42nd Street, New York, NY 10017 (US).		(81) Designated States: AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZW, ARIPO patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), Eurasian patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG). Published <i>With international search report.</i>	
(54) Title: ARYL FUSED AZAPOLYCYCLIC COMPOUNDS  (I) (57) Abstract Compounds of formula (I) and their pharmaceutically acceptable salts, wherein R¹, R², R³ and n are defined as in the specification, intermediates in the synthesis of such compounds, pharmaceutical compositions containing such compounds and methods of using such compounds in the treatment of neurological and psychological disorders are claimed.			

240747

5

ARYL FUSED AZAPOLYCYCLIC COMPOUNDS

Background of the Invention

This invention relates to aryl fused azapolycyclic compounds, as defined more specifically by formula I below. Compounds of formula I bind to neuronal nicotinic acetylcholine specific receptor sites and are useful in modulating cholinergic function. Such compounds are
10 useful in the treatment of inflammatory bowel disease (including but not limited to ulcerative colitis, pyoderma gangrenosum and Crohn's disease), irritable bowel syndrome, spastic dystonia, chronic pain, acute pain, celiac sprue, pouchitis, vasoconstriction, anxiety, panic disorder, depression, bipolar disorder, autism, sleep disorders, jet lag, amyotrophic lateral sclerosis (ALS), cognitive dysfunction, hypertension, bulimia, anorexia, obesity, cardiac
15 arrhythmias, gastric acid hypersecretion, ulcers, pheochromocytoma, progressive supramuscular palsy, chemical dependencies and addictions (e.g., dependencies on, or addictions to nicotine (and/or tobacco products), alcohol, benzodiazepines, barbituates, opioids or cocaine), headache, stroke, traumatic brain injury (TBI), obsessive-compulsive disorder, psychosis, Huntington's Chorea, tardive dyskinesia, hyperkinesia, dyslexia, schizophrenia, multi-infarct
20 dementia, age related cognitive decline, epilepsy, including petit mal absence epilepsy, senile dementia of the Alzheimer's type (AD), Parkinson's disease (PD), attention deficit hyperactivity disorder (ADHD) and Tourette's Syndrome.

The compounds of this invention may also be used in combination with an antidepressant such as, for example, a tricyclic antidepressant or a serotonin reuptake inhibiting
25 antidepressant (SRI), in order to treat both the cognitive decline and depression associated with AD, PD, stroke, Huntington's Chorea or traumatic brain injury (TBI); in combination with muscarinic agonists in order to stimulate both central muscarinic and nicotinic receptors for the treatment, for example, of ALS, cognitive dysfunction, age related cognitive decline, AD, PD, stroke, Huntington's Chorea and TBI; in combination with neurotrophic factors such as NGF in
30 order to maximize cholinergic enhancement for the treatment, for example, of ALS, cognitive dysfunction, age related cognitive decline, AD, PD stroke, Huntington's Chorea and TBI; or in combination with agents that slow or arrest AD such as cognition enhancers, amyloid aggregation inhibitors, secretase inhibitors, tau kinase inhibitors, neuronal antiinflammatory agents and estrogen-like therapy.

241

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RADICACIÓN: 0-63870

EDICTO No. 2918

LA SECRETARÍA GENERAL AD-HOC
HACE SABER:

Que esta Superintendencia profirió Resolución No. 1988 de 31-ENE-2006. Que el contenido de la parte resolutive es como sigue: El Superintendente de Industria y Comercio.

RESUELVE

ARTICULO PRIMERO: Negar el privilegio de patente de invención para la solicitud correspondiente a "UNA COMPOSICION FARMACEUTICA PARA TRATAR LA DEPENDENCIA O ADICCION A LA NICOTINA, QUE COMPRENDE UN AGONISTA PARCIAL DEL RECEPTOR NICOTINICO Y UN AGENTE ANTIDEPRESIVO O ANSIOLITICO".

ARTICULO SEGUNDO: Notificar personalmente el contenido de la presente resolución al doctor Carlos Olarte, o a quien haga sus veces, en su calidad de apoderado de Pfizer Products Inc., entregándole copia de la misma, advirtiéndole que contra ella procede el recurso de reposición interpuesto ante el Superintendente de Industria y Comercio, al momento de la notificación o dentro de los 5 días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CUMPLASE

Dada en Bogotá, D.C., a los 31 ENE. 2006

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,

JAIR BUSTOZ COBAR

Para notificar a los interesados, se fija el presente EDICTO en lugar visible al público en la SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO, por el término de (10) diez días hábiles contados a partir de las 8:30 a.m. de hoy.

Secretaría General Ad-Hoc 21-FEB-2006 Este edicto se desfija hoy 06-MAR-2006 a las cinco (5:00 p.m.)
Secretaría General Ad-Hoc
EDICTO No. 2918