

104
106

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicacion : 02103448 00000002

Folios: 14

Fecha (HDD): 2003-06-11 16:11:58

Tramite : 011 PCT-PATENT 329 FASE NACI 329 COMPLETEN
oponencia: 2003 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Re: P1.-ELI LILLY AND COMPANY.-Solicitud de Patente de
Invención en Fase Nacional PCT para "DERIVADOS
SULFONAMIDA".-Clase C07C 311/05.-Expediente número
02-103.448.-

1. Me refiero a mi memorial de 11 de Marzo de 2003.

2. Por medio del presente me permito manifestar a usted que en ejercicio del derecho conferido por el Artículo 28 numeral 1 del Tratado de Cooperación en materia de Patentes PCT, el capítulo reivindicatorio tal como fue presentado originalmente en Fase Internacional fue modificado al momento de su presentación en Fase Nacional, quedando con 22 reivindicaciones.

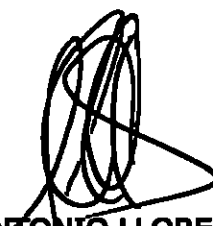
29.

Las modificaciones realizadas se encuentran plenamente sustentadas en la descripción de la presente invención y en este sentido, no configuran una ampliación del invento o de la divulgación contenida en la solicitud presentada.

3. Por consiguiente anexo me permito presentar copia del capítulo reivindicatorio correspondiente a la solicitud de la referencia, que consta de 29 reivindicaciones, tal como fue presentado originalmente en Fase Internacional, junto con su traducción.

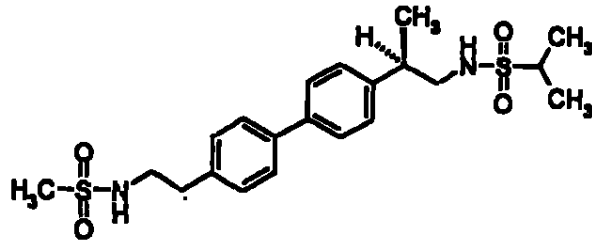
4. Ruego a usted tomar atenta nota de lo anterior y proceder de conformidad.

Señor Superintendente,


JOSE ANTONIO LLORED A
T.P. 10.784
Código 231

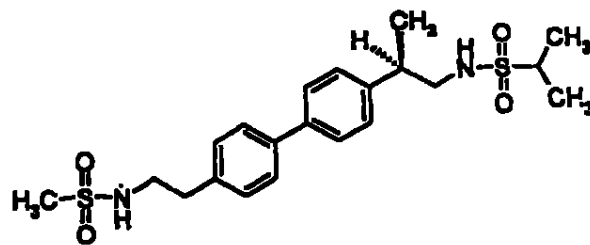
REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula:

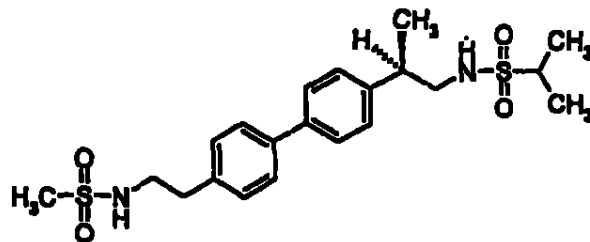


ó una sal farmacéuticamente aceptable de éste.

2. Un compuesto de fórmula:

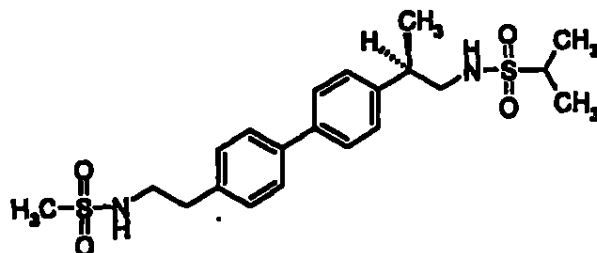


3. Una composición que comprende un compuesto de fórmula:



ó una sal farmacéuticamente aceptable de éste, en combinación con un vehículo portador, diluyente ó excipiente farmacéuticamente aceptable.

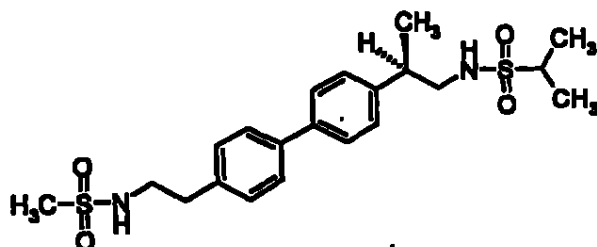
4. Un método para potenciar la función de los receptores del glutamato en un paciente, método el cual comprende la administración a dicho paciente de una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula:



ó una sal farmacéuticamente aceptable de éste.

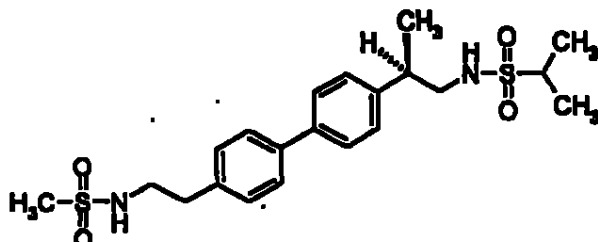
Te

5. Un método de tratamiento de la depresión en un paciente que comprende la administración a dicho paciente de una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula:



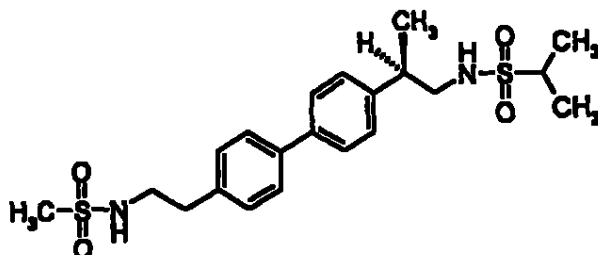
ó una sal farmacéuticamente aceptable de éste.

6. Un método de tratamiento de la esquizofrenia en un paciente, el cual comprende la administración a dicho paciente de una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula:



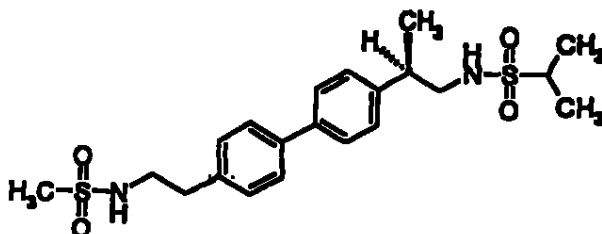
ó una sal farmacéuticamente aceptable de éste.

7. Un método para el tratamiento de los desórdenes cognitivos en un paciente, método que comprende la administración a dicho paciente de una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula:



ó una sal farmacéuticamente aceptable de éste.

8. Un producto de manufactura que comprende material de empaque y un compuesto de fórmula



ó una sal farmacéuticamente aceptable de éste, contenido dentro dicho material de empaque, en donde dicho material de empaque comprende una etiqueta la cual indica que dicho compuesto puede usarse para el tratamiento de por lo menos una de las siguientes condiciones: Enfermedad de Alzheimer, esquizofrenia, déficits cognitivos asociados con esquizofrenia, depresión, y desórdenes cognitivos.

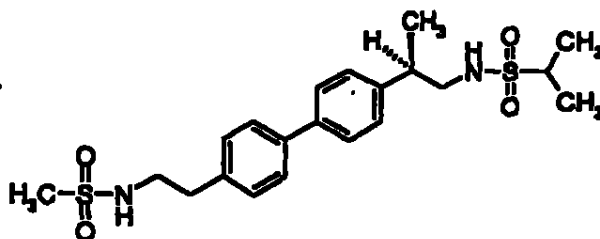
9. Un producto de manufactura acorde con la Reivindicación 8, en donde dicha etiqueta indica que dicho compuesto puede usarse para el tratamiento de la enfermedad de Alzheimer.

10. Un producto de manufactura acorde con la Reivindicación 8, en donde dicha etiqueta indica que dicho compuesto puede usarse para tratar la esquizofrenia.

11. Un producto de manufactura acorde con la Reivindicación 8, en donde dicha etiqueta indica que dicho compuesto puede usarse para tratar la depresión.

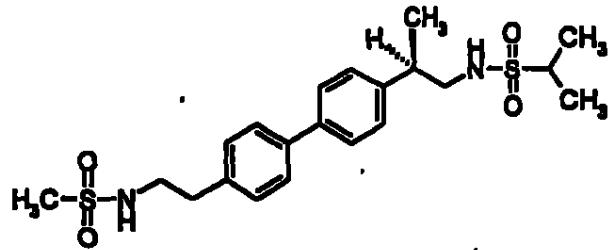
12. Un producto de manufactura acorde con la Reivindicación 8, en donde dicha etiqueta indica que dicho compuesto puede usarse para tratar déficits cognitivos asociados con la esquizofrenia.

13. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de fórmula:



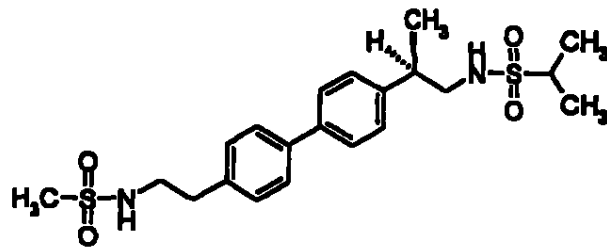
ó una sal farmacéuticamente aceptable de éste, en una cantidad entre aproximadamente 5 microgramos y 500 microgramos.

14. Una composición farmacéutica acorde con la Reivindicación 13, en donde el compuesto de fórmula:



ó una sal farmacéuticamente aceptable de éste, está presente en una cantidad situada entre aprox. 5 microgramos - 200 microgramos.

15. Una composición farmacéutica acorde con la Reivindicación 13, en donde el compuesto de fórmula:



ó una sal farmacéuticamente aceptable de éste, está presente en una cantidad de aprox. 5 microgramos - 100 microgramos.

16. Una composición farmacéutica preparada a través de un proceso que comprende la disolución de la {(2R)-2-[4-(4-{2-[(metilsulfonyl)amino]etil}fenil)fenil]propil}[(metiletil)sulfonyl]amina en un apropiado polietilenglicol en forma líquida, y el posterior enfriamiento de la solución a temperatura ambiente.

17. Una composición farmacéutica acorde con la Reivindicación 16, en donde el polietilenglicol apropiado es el polietilenglicol 3350.

18. Una composición farmacéutica acorde con la Reivindicación 17, en donde la composición farmacéutica se llena en cápsulas apropiadas.

19. Una composición farmacéutica acorde con la Reivindicación 18, en donde las cápsulas apropiadas son las cápsulas de gelatina dura.

20. Una composición farmacéutica acorde con la Reivindicación 18, en donde la $\{(2R)-2-[4-(4-[2-[(\text{metilsulfonil})\text{amino}]\text{etil}]\text{fenil})\text{fenil}]\text{propil}\}[(\text{metiletil})\text{sulfonil}]\text{amina}$ está presente en una cantidad de aprox. 5 microgramos - 500 microgramos en cada cápsula apropiada.

21. Una composición farmacéutica que comprende, una disolución de $\{(2R)-2-[4-(4-[2-[(\text{metilsulfonil})\text{amino}]\text{etil}]\text{fenil})\text{fenil}]\text{propil}\}[(\text{metiletil})\text{sulfonil}]\text{amina}$ y un polietilenglicol apropiado.

22. Una composición farmacéutica acorde con la Reivindicación 21, en donde el polietilenglicol apropiado es el PEG 3350.

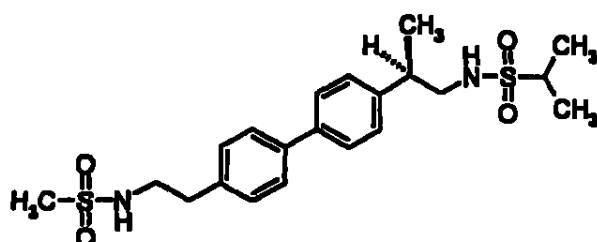
X

23. Una composición farmacéutica acorde con la Reivindicación 21, en donde la $\{(2R)-2-[4-(4-[2-[(\text{metilsulfonil})\text{amino}]\text{etil}]\text{fenil})\text{fenil}]\text{propil}\}[(\text{metiletil})\text{sulfonil}]\text{amina}$ está presente en una cantidad entre aprox. 5 microgramos - 500 microgramos.

>

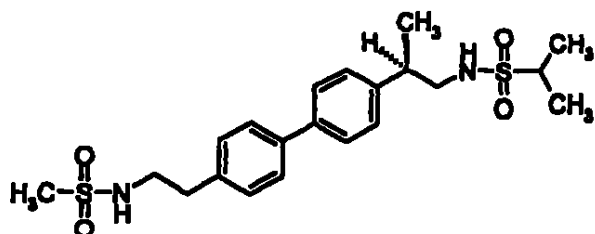
24. Una composición farmacéutica acorde con la Reivindicación 21, en donde la $\{(2R)-2-[4-(4-[2-[(\text{metilsulfonil})\text{amino}]\text{etil}]\text{fenil})\text{fenil}]\text{propil}\}[(\text{metiletil})\text{sulfonil}]\text{amina}$ está presente en una cantidad de aprox. 5 microgramos - 500 microgramos y el polietilenglicol apropiado es el PEG 3350.

25. Uso de un compuesto de fórmula:



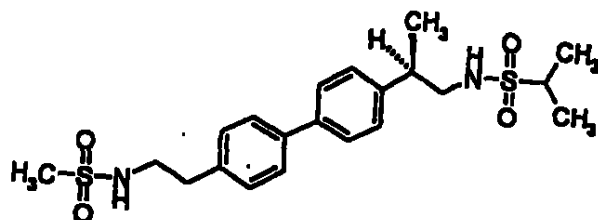
en la manufactura de un medicamento para el tratamiento de la enfermedad de Alzheimer.

26. Uso de un compuesto de fórmula:



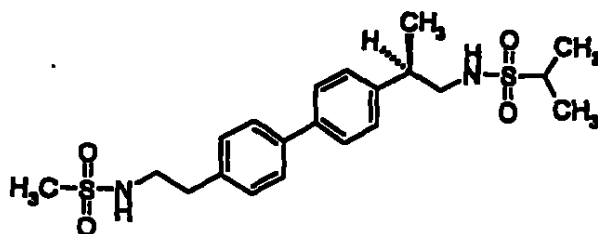
en la manufactura de un medicamento para tratar la esquizofrenia.

27. Uso de un compuesto de fórmula:



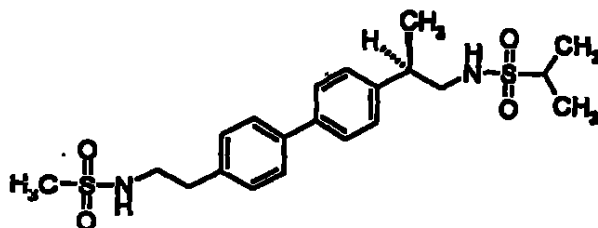
para la manufactura de un medicamento para tratar déficits cognitivos asociados con la esquizofrenia.

28. Un compuesto de fórmula:



ó una sal farmacéuticamente aceptable de éste, de uso como producto farmacéutico.

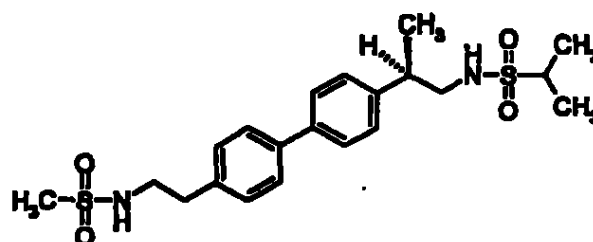
29. Un compuesto de fórmula:



ó una sal farmacéuticamente aceptable de éste, en la manufactura de un medicamento para potenciar la función de los receptores del glutamato.

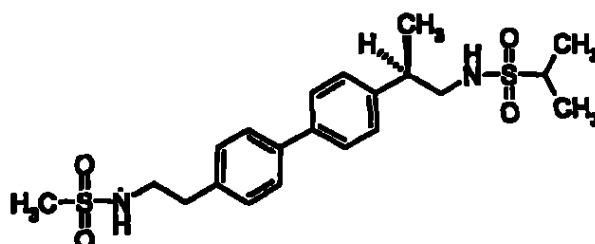
WE CLAIM:

1. A compound of the formula:

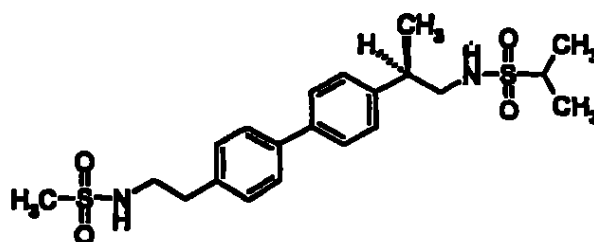


5 or a pharmaceutically acceptable salt thereof.

2. A compound of the formula:

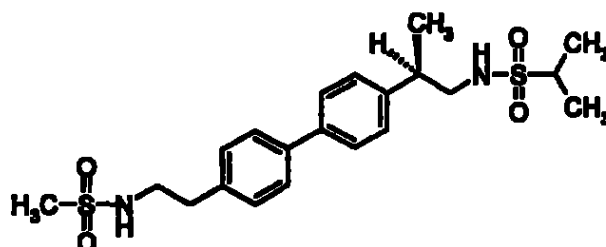


10 3. A composition comprising a compound of the formula:



or a pharmaceutically acceptable salt thereof in combination with a pharmaceutically acceptable carrier, diluent or excipient.

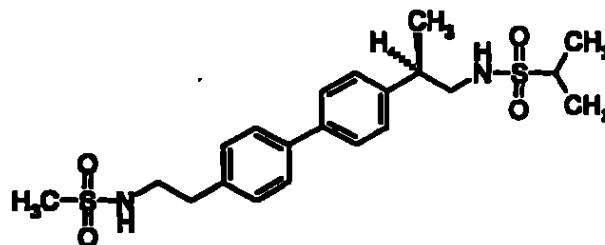
4. A method of potentiating glutamate receptor function in a patient, which comprises administering to said patient an effective amount of a compound of the formula:



5

or a pharmaceutically acceptable salt thereof.

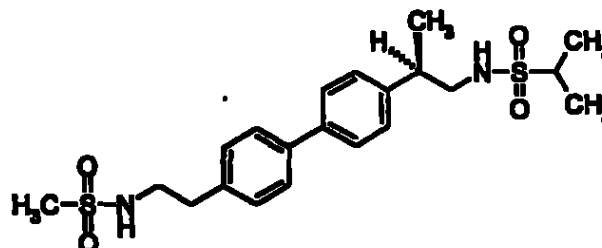
5. A method of treating depression in a patient comprising administering to said patient an effective amount of a compound of the formula:



10

or a pharmaceutically acceptable salt thereof.

6. A method of treating schizophrenia in a patient comprising administering to said patient an effective amount of a compound of the formula:



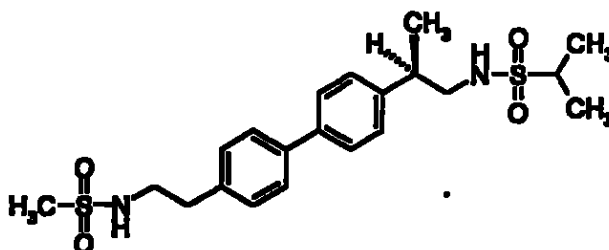
15

or a pharmaceutically acceptable salt thereof.

113 ~~115~~

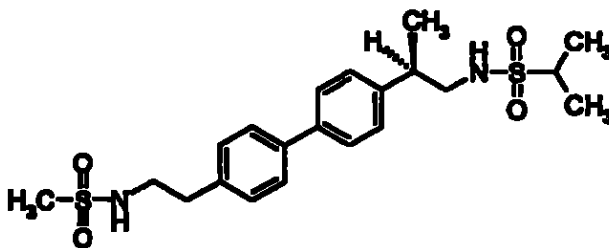
-41-

7. A method of treating cognitive disorders in a patient comprising administering to said patient an effective amount of a compound of the formula:



5 or a pharmaceutically acceptable salt thereof.

8. An article of manufacture comprising packaging material and a compound of formula:



10 or a pharmaceutically acceptable salt thereof contained within said packaging material, wherein said packaging material comprises a label which indicates that said compound can be used for treating at least one of the following; Alzheimer's disease, schizophrenia, cognitive deficits associated with schizophrenia, depression, and cognitive disorders.

15

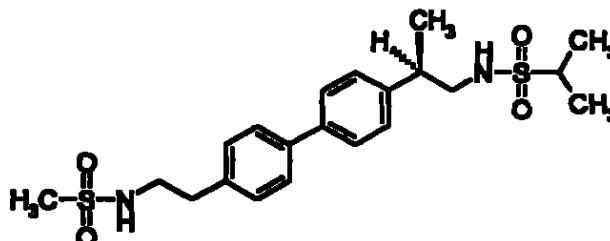
9. An article of manufacture according to claim 8 wherein said label indicates that said compound can be used for treating Alzheimer's disease.

20 10. An article of manufacture according to claim 8 wherein said label indicates that said compound can be used for treating schizophrenia.

11. An article of manufacture according to claim 8 wherein said label indicates that said compound can be used for treating depression.

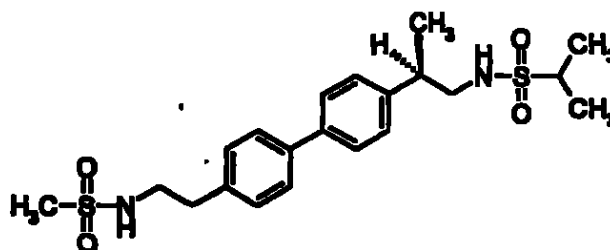
12. An article of manufacture according to claim 8 wherein said label indicates that said compound can be used for treating cognitive deficits associated with schizophrenia.

5 13. A pharmaceutical composition comprising a compound of formula:



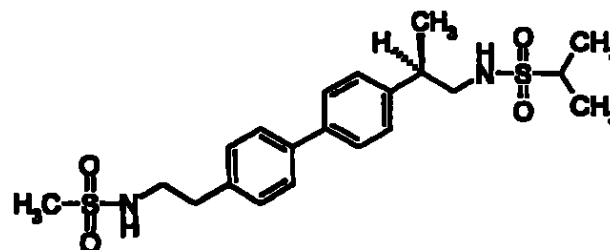
or a pharmaceutically acceptable salt thereof, in an amount of about 5 micrograms to about 500 micrograms.

10 14. A pharmaceutical composition according to claim 13 wherein the compound of formula:



or a pharmaceutically acceptable salt thereof, is present in an amount of about 5 micrograms to about 200 micrograms.

15 15. A pharmaceutical composition according to claim 13 wherein the compound of formula:



20 or a pharmaceutically acceptable salt thereof, is present in an amount of about 5 micrograms to about 100 micrograms.

-43-

16. A pharmaceutical composition prepared by a process comprising dissolving {(2R)-2-[4-(4-{2-
[(methylsulfonyl)amino]ethyl}phenyl)phenyl]propyl}[(methylethyl)sulfonyl]amine in
a suitable polyethylene glycol in liquid form, and then cooling the solution to room
5 temperature.

17. A pharmaceutical composition according to claim 16 wherein the
suitable polyethylene glycol is polyethylene glycol 3350.

10 18 A pharmaceutical composition according to claim 17 wherein the
pharmaceutical composition is filled into suitable capsules.

19. A pharmaceutical composition according to claim 18 wherein the
suitable capsules are hard gelatin capsules.

15

20. A pharmaceutical composition according to claim 18 wherein the
{(2R)-2-[4-(4-{2-
[(methylsulfonyl)amino]ethyl}phenyl)phenyl]propyl}[(methylethyl)sulfonyl]amine is
present in an amount of about 5 micrograms to about 500 micrograms in each
20 suitable capsule.

21. A pharmaceutical composition comprising, dissolving {(2R)-2-[4-(4-{2-
[(methylsulfonyl)amino]ethyl}phenyl)phenyl]propyl}[(methylethyl)sulfonyl]amine
and a suitable polyethylene glycol.

25

22. A pharmaceutical composition according to claim 21 wherein the
suitable polyethylene glycol is PEG 3350.

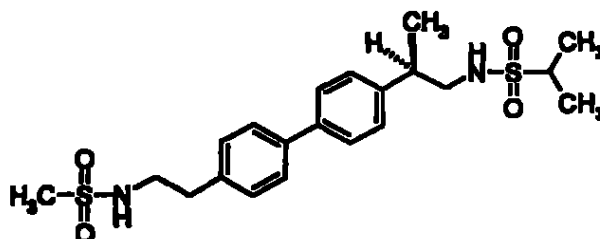
23. A pharmaceutical composition according to claim 21 wherein the {(2R)-
30 2-[4-(4-{2-[(methylsulfonyl)amino]ethyl}phenyl)phenyl]-
propyl}[(methylethyl)sulfonyl]amine is present in an amount of about 5
micrograms to about 500 micrograms.

-44-

24. A pharmaceutical composition according to claim 21 wherein the {(2R)-2-[4-(4-[2-[(methylsulfonyl)amino]ethyl)phenyl]phenyl]propyl}[(methylethyl)sulfonyl]amine is present in an amount of about 5 micrograms to about 500 micrograms and the suitable polyethylene glycol is PEG 3350.

5

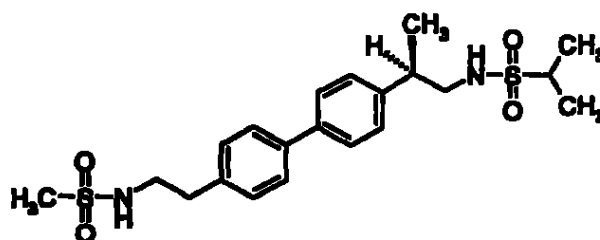
25. Use of a compound of formula:



for the manufacture of a medicament for treating Alzheimer's disease.

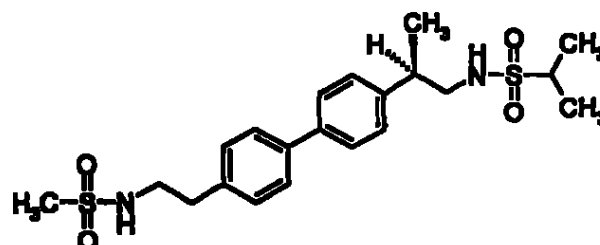
10

26. Use of a compound of formula:



for the manufacture of a medicament for treating schizophrenia.

27. Use of a compound of formula:



15

for the manufacture of a medicament for treating cognitive deficits associated with schizophrenia.

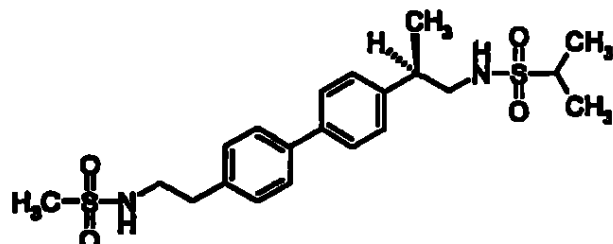
117 119

WO 01/90057

PCT/US01/11747

-45-

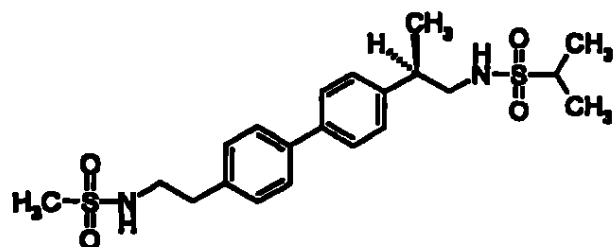
28. A compound of formula:



or a pharmaceutically acceptable salt thereof for use as a pharmaceutical.

5

29. A compound of formula:



or a pharmaceutically acceptable salt thereof for the manufacture of a medicament for potentiating glutamate receptor function.

118

INFORME DE PROTOCOLO

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO			SISTEMA DE REGISTRO		
			Fecha 21/08/2003		
MANTENIMIENTO DE PROTOCOLOS					
Numero : 11271					
Fecha : 01/12/1986					
Conferido: ELILILLYAND COMPANY					
País : US ESTADOS UNIDOS DE AMERICA					
Ciudad : 52 INDIANAPOLIS, INDIANA					
Represent: 8 Sustituir : 8 Desistir : 8					
No. Radicacion : Clase: Seev: Seac:					
Presencia	Codigo	Ctr	Nombre		
1	231	A	LLOREDA CAMACHO JOSE		
2	231	B	LLOREDA JOSE ANTONIO		
3	231	C	LLOREDA LUIS FERNANDO		
Encontrados <1/1> registro(s)					

2020
Bogotá DC

119

Doctor(a)
JOSÉ ANTONIO LLOREDA
Apoderado(a)

Oficio No. 1029

REFERENCIA:	Radicación No.	02-103448
	Solicitud Internacional	PCT/US01/11747
	Fecha inicio fase nacional	19/12/2002
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	416
	Folios	001

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, el Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), el Reglamento y la Circular Unica de la Superintendencia de Industria y Comercio, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de Comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial.

Cúmplase

Dado en Bogotá DC,

22 de mayo 2003

ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de la División de Nuevas Creaciones

/202023

532