

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicación : 02103450 00000002
Fecha (ARD): 2003-06-11 16:10:19
Trámite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NACI 329 COMPLEMEN
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
00114
Folios: 16

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

Re: P1.-ELI LILLY AND COMPANY.-Solicitud de Patente de
Invención en Fase Nacional PCT para "DERIVADOS
SULFONAMIDA".-Clase C07C 311/05.-Expediente
número 02-103.450.-

1. Me refiero a mi memorial de 12 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 13 reivindicaciones.

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 21 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.

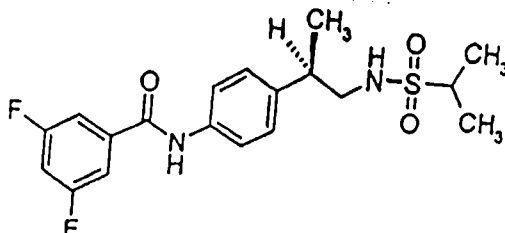
Señor Superintendente,



JOSE ANTONIO LLOREDA
T.P. 10.784
Código 231

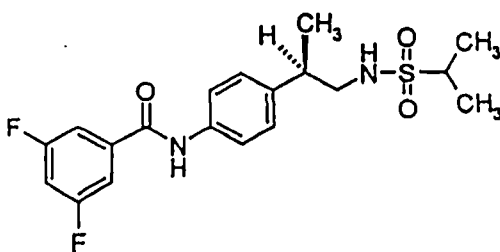
Reivindicaciones

1. Un compuesto de fórmula:

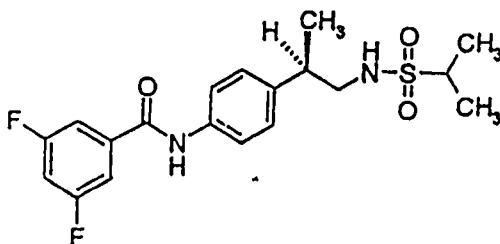


ó una sal farmacéuticamente aceptable de éste.

2. Un compuesto de fórmula:

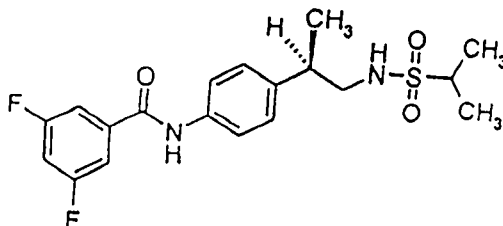


3. Una composición que comprende un compuesto de fórmula:



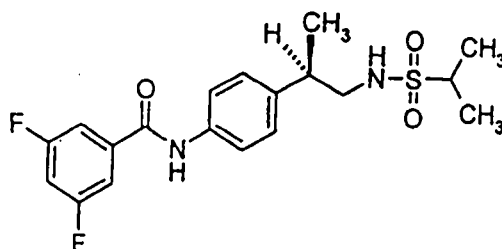
ó una sal farmacéuticamente aceptable de éste, en combinación con un vehículo portador, diluyente ó excipiente farmacéuticamente aceptable.

4.  Un método de potenciación de 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:



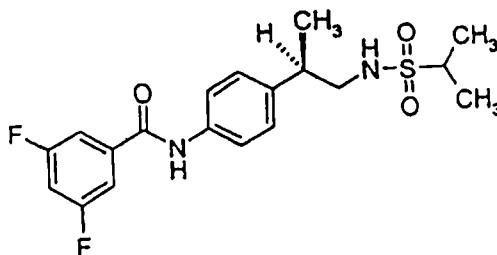
ó una sal farmacéuticamente aceptable de éste.

5. ~~X~~ 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:



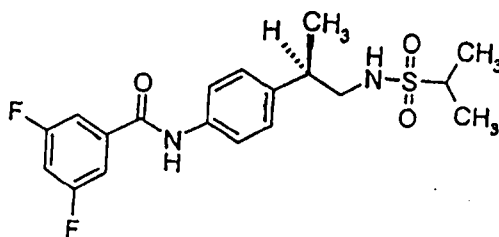
ó una sal farmacéuticamente aceptable de éste.

6. ~~X~~ 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:



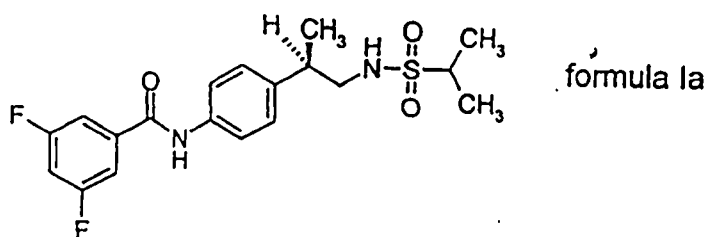
ó una sal farmacéuticamente aceptable de éste.

7. ~~X~~ Un método de 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:

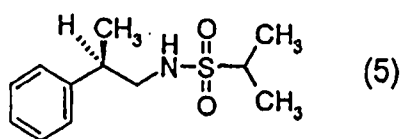


ó una sal farmacéuticamente aceptable de éste.

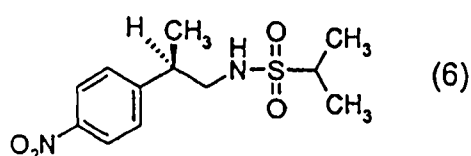
8. Un proceso para la preparación de un compuesto de fórmula Ia:



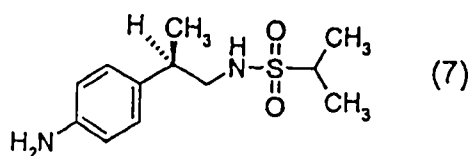
proceso el cual comprende, la nitración de una sulfonamida (5):



a fin de obtener un derivado p-nitro (6):

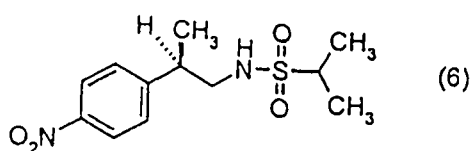


hidrogenación del derivado p-nitro (6) para producir un derivado p-amino (7):

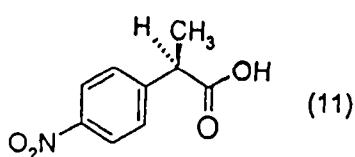


tratamiento del derivado p-amino (7) con un ácido apropiado, y luego tratar con una base apropiada, y finalmente el tratamiento con cloruro de 3,5-difluorobenzoilo.

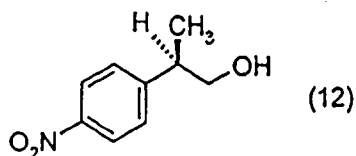
9. Un proceso para la preparación de la sulfonamida (6):



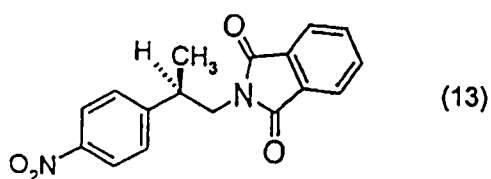
el cual comprende, la reducción del ácido (11):



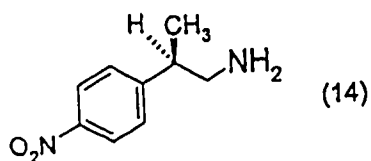
para obtener un alcohol primario (12):



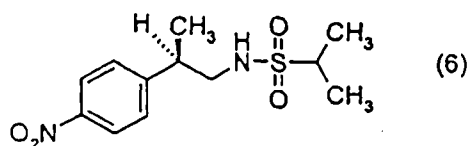
tratamiento del alcohol primario (12) con ftalimida, trifenilfosfina y DEAD para producir el derivado ftalimida(13):



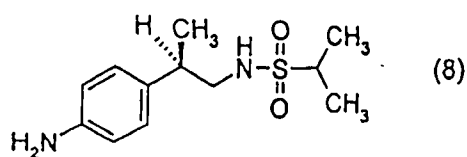
tratamiento del derivado ftalimida(13) con hidrazina para obtener la amina primaria (14);



tratamiento de la amina primaria (14) con $\text{Lg-SO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ en donde Lg representa un grupo saliente apropiado, para producir la sulfonamida (6):

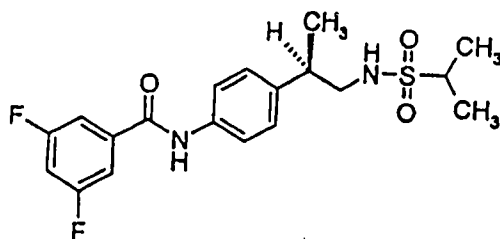


10. Un proceso acorde con la Reivindicación 9, el cual comprende adicionalmente la hidrogenación de la sulfonamida (6) para obtener así la base libre (8):



y el tratamiento de la base libre (8) con cloruro de 3,5-difluorobenzilo.

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



ó una sal farmacéuticamente aceptable de éste, contenidos dentro de 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 patológicas: enfermedad de Alzheimer, esquizofrenia, déficits cognitivos asociados con la esquizofrenia, la depresión, y los desórdenes cognitivos.

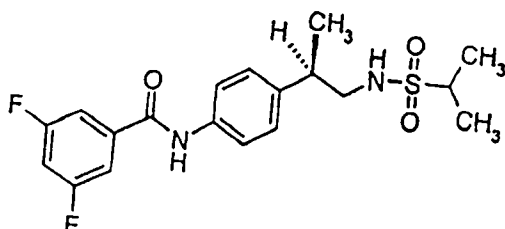
12. Un producto de manufactura acorde con la Reivindicación 11, en donde dicha etiqueta indica que dicho compuesto puede usarse para el tratamiento de la enfermedad de Alzheimer.

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

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

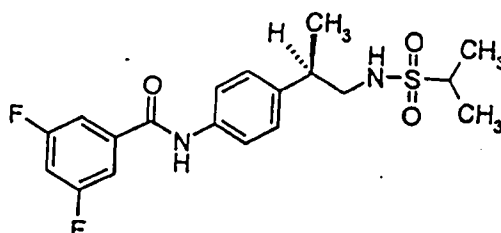
15. Un producto de manufactura acorde con la Reivindicación 11, en donde dicha etiqueta indica que dicho compuesto pueden usarse para el tratamiento de déficits cognitivos asociados con la esquizofrenia.

16. ~~*~~ El uso de un compuesto de fórmula:



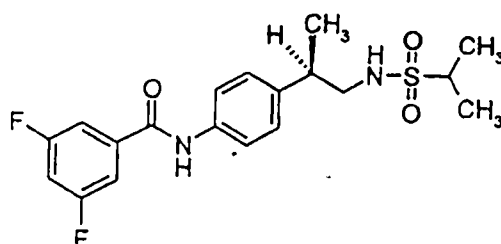
para la manufactura de un medicamento para la potenciación de la función de los receptores del glutamato.

17. El uso de un compuesto de fórmula:



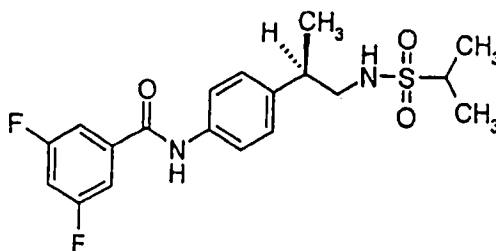
para la manufactura de un medicamento para el tratamiento de la enfermedad de Alzheimer.

18. El uso de un compuesto de fórmula:



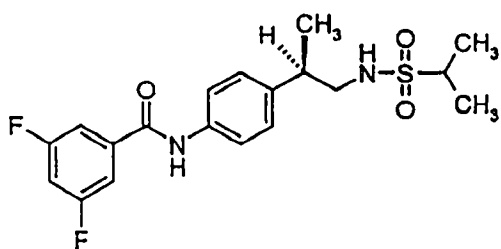
para la manufactura de un medicamento para tratar la esquizofrenia.

19. El uso de un compuesto de fórmula:



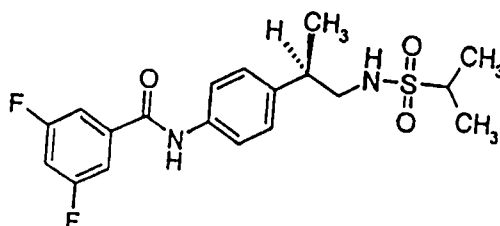
para la manufactura de un medicamento para tratar los déficits cognitivos asociados con la esquizofrenia.

20. Un compuesto de fórmula:



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

21. Un compuesto de fórmula:

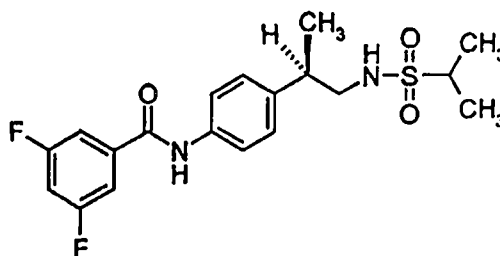


ó una sal farmacéuticamente aceptable de éste, para la manufactura de un medicamento para potenciar la función de los receptores del glutamato.

-41-

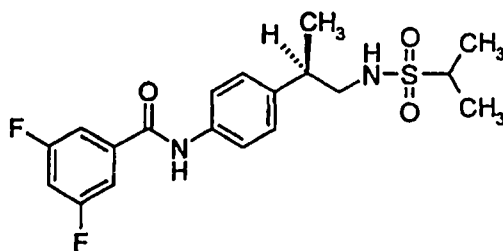
WE CLAIM:

1. A compound of the formula:

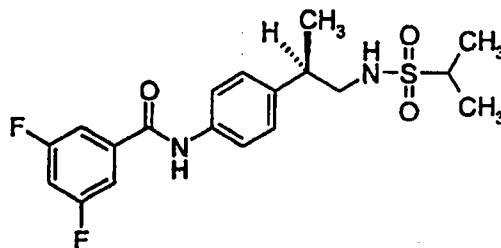


- 5 or a pharmaceutically acceptable salt thereof.

2. A compound of the formula:

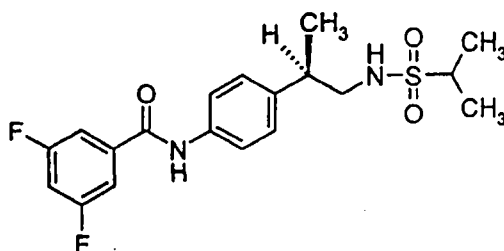


- 10 3. A composition comprising a compound of the formula:



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

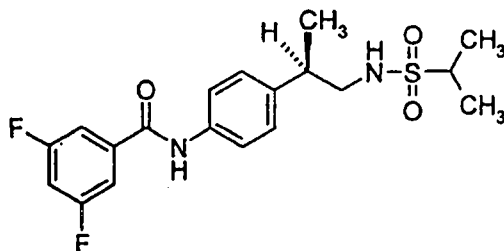
4. A method of potentiating glutamate receptor function in a patient, which comprises administering to said patient an effective amount of a compound of the formula:



5

or a pharmaceutically acceptable salt thereof.

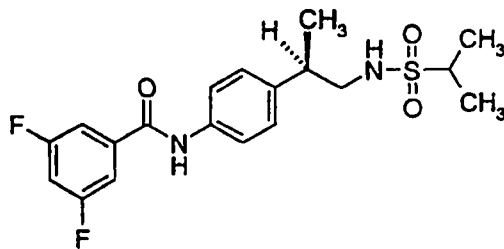
5. A method of treating depression in a patient comprising administering to said patient an effective amount of a compound of the formula:



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:

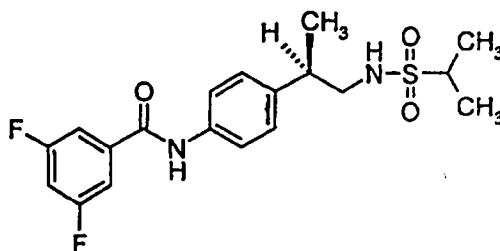


15

or a pharmaceutically acceptable salt thereof.

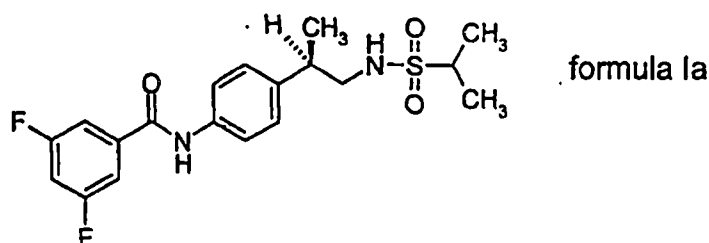
-43-

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

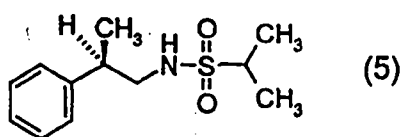


5 or a pharmaceutically acceptable salt thereof.

8. A process for the preparation of a compound of formula 1a:

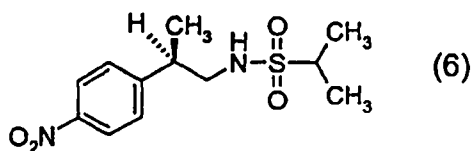


comprising, nitrating a sulfonamide (5):

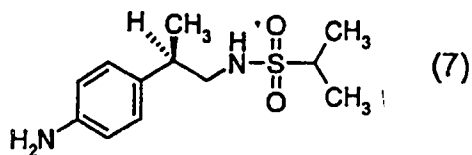


10

to provide a p-nitro derivative (6):



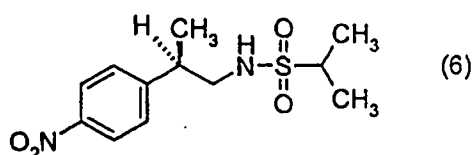
hydrogenating the p-nitro derivative (6) to provide a p-amino derivative (7):



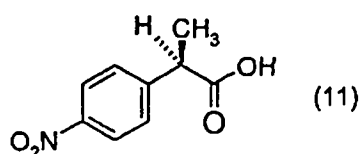
15 treating the p-amino derivative (7) with a suitable acid, then treating with a suitable base, and then treating with 3,5-difluorobenzoyl chloride.

9. A process for the preparation of sulfonamide (6):

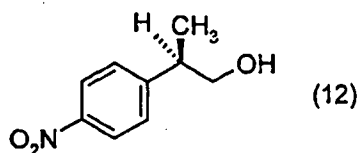
-44-



comprising, reducing acid (11):

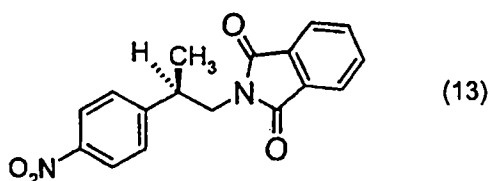


to provide a primary alcohol (12):



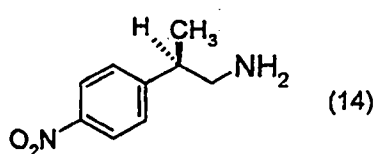
5

treating primary alcohol (12) with phthalimide, triphenylphosphine and DEAD to provide the phthalimide derivative (13):

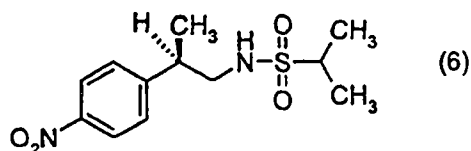


10

treating the phthalimide derivative (13) with hydrazine to provide primary amine (14);

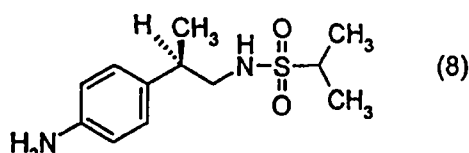


treating the primary amine (14) with $\text{Lg-SO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, wherein Lg represents a suitable leaving group, to provide sulfonamide (6):



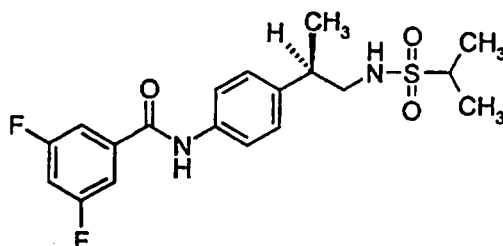
-45-

10. A process according to claim 9 further comprising, hydrogenating sulfonamide (6) to provide free base (8):



5 treating free base (8) with 3,5-difluorobenzoyl chloride.

11. 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

12. An article of manufacture according to claim 11 wherein said label indicates that said compound can be used for treating Alzheimer's disease.

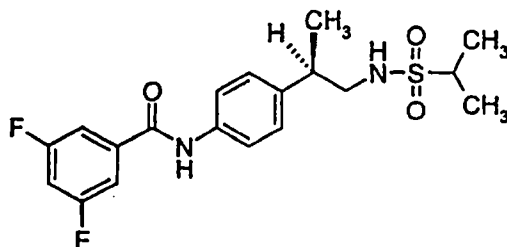
13. An article of manufacture according to claim 11 wherein said label
20 indicates that said compound can be used for treating schizophrenia.

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

-46-

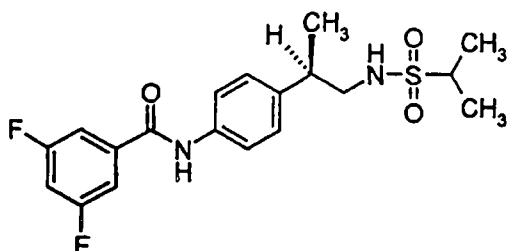
15. An article of manufacture according to claim 11 wherein said label indicates that said compound can be used for treating cognitive deficits associated with schizophrenia.

5 16. Use of a compound of formula:



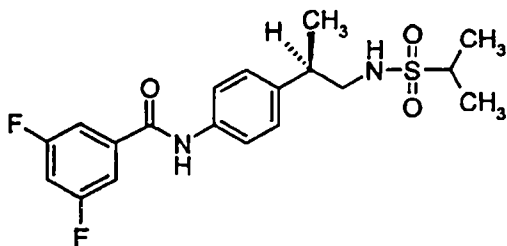
for the manufacture of a medicament for potentiating glutamate receptor function.

10 17. Use of a compound of formula:



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

18. Use of a compound of formula:

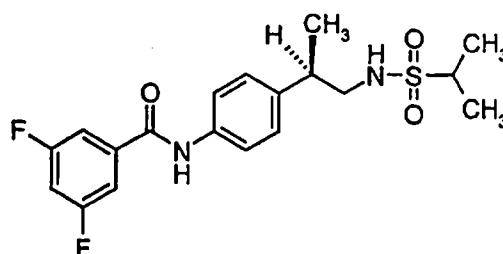


15

for the manufacture of a medicament for treating schizophrenia.

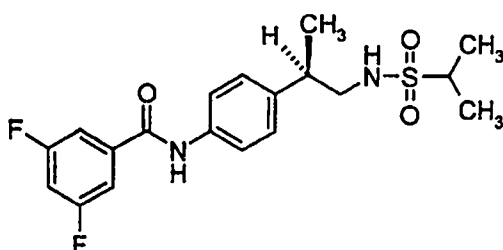
-47-

19. Use of a compound of formula:



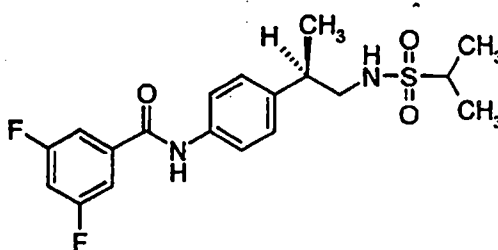
5 for the manufacture of a medicament for treating cognitive deficits associated with schizophrenia.

20. A compound of formula:



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

21. A compound of formula:



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

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**

Pais : US ESTADOS UNIDOS DE AMERICA

Ciudad : 52 INDIANAPOLIS, INDIANA

Represent: S Sustituir: S Desistir: S

No. Radicacion : Clase: Seev: Seac:

scncia Codigo Ctr Nombre
1 . 231 A **LLOREDAMACHO JOSE**
2 231 B **LLOREDAMACHO JOSE ANTONIO**
3 231 C **LLOREDAMACHO LUIS FERNANDO**

Encontrados (1/1) registro(s)

2020
Bogotá DC

Doctor(a)
JOSÉ ANTONIO LLOREDA
Apoderado(a)

Oficio No. 1028

REFERENCIA:	Radicación No.	02-103450
	Solicitud Internacional	PCT/US01/11746
	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 Única 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 AGO. 2003


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

/202023