

OLARTE RAISBECK

OLARTE RAISBECK & FRIERI LTDA.

Servicios Legales y Profesionales

World Trade Center – Torre C
Calle 100 No. 8A-55, Piso 10
Bogotá D.C., Colombia
Tel +57 1 638-6200
Fax +57 1 638-6201
Nir 830 122 870-6
office@olarteraisbeck.com
www.olarteraisbeck.com

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____

160 9/11
SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 03069212 00000001 Folios: 5
Fecha (AMD): 2004-01-29 08:50:43
Tramite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NACI 538 PETICION
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Ref: Expediente No. **03.069.212**

Solicitud de patente de invención titulada:

“USO DE AGONISTAS INVERSOS DE GABA_A EN COMBINACION CON AGONISTAS PARCIALES DEL RECEPTOR DE NICOTINA, ESTROGENOS, MODULADORES SELECTIVOS DE ESTROGENOS O VITAMINA E, PARA EL TRATAMIENTO DE TRANSTORNOS COGNITIVOS”.

Solicitante: **PFIZER PRODUCTS INC.**

SOLICITUD DE EXAMEN DE PATENTABILIDAD SEGÚN EL ARTICULO 44 DE LA DECISION 486, GACETA No. 534

CARLOS R. OLARTE, mayor de edad y vecino de Bogotá, D.C., identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi condición de apoderado del solicitante, según consta en el nuevo poder adjunto, respetuosamente me permito solicitar, que se examine si la invención reúne los requisitos de patentabilidad previstos en la misma. Dando cumplimiento a lo establecido en el artículo 44 de la Decisión 486 de la comisión de la Comunidad Andina de Naciones. Adjunto recibo por el monto de \$177.000 pesos para cubrir la tasa correspondiente, según la Resolución 37323 del año 2003.

Aprovecho la presente oportunidad para poner en conocimiento del Despacho mi cambio de oficinas, por lo que de ahora en adelante, recibiré notificaciones en la Calle 100 No. 8A-55 Torre C, Piso 10, World Trade Center, o en la secretaría de ese Despacho.

Atentamente,

CARLOS R. OLARTE
C.C. 79.782.747 de Bogotá
T.P. 74.295

Anexo: Recibo por \$177.000 pesos
Poder

**DILIGENCIA DE RECONOCIMIENTO
Y PRESENTACION PERSONAL**
Ante el Notario Once del Círculo de Santafé de Bogotá, compareció Carlos R. Olarte
Quien exhibió la C.C. No. 79782797
expedida en Bogotá C.P. 74293
y declaró que la firma y huella que aparece en el presente memorial son suyas y que el contenido del mismo es cierto.
Memorial dirigido a _____
Santafé de Bogotá, D.C. **11.9 ENE 2004**

Firma del Declarante

HUELLA
Autorizó la anterior Diligencia
NOTARIO ONCE DEL CIRCULO DE SANTAFE DE BOGOTA

REPÚBLICA DE COLOMBIA
NOTARIA 11 DEL CIRCULO DE
SANTAFE DE BOGOTA, D.C.

MONICA Z. BAUTISTA N.
NOTARIA ONCE (E)

161
2/2

NIT : 800176009-2

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 03069212 00000001
Fecha (ARD): 2004-01-29 08:50:43
Tramite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NACI 538 PETICION
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
Folios: 5

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 04 - 6,395
FECHA : ENERO 20 DE 2004

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
FREDERICK TORRES	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	13574216	27/01/2004	2,074,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-01 SOLICITUDES	114 PTC CAP-II EXAMEN DE PATENTIBILID	177,000.00
	TOTAL :	\$ 177,000.00

SON: CIENTO SETENTA Y SIETE MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE N°. _____

162
313

Traducción oficial del Inglés por Marlén Neira Castro, resolución
2117 del Ministerio de Justicia de Colombia

APOSTILLA EN PODER DE REPRESENTACIÓN DE

PFIZER PRODUCTS INC.

Bilingüe inglés- español otorgado en Nueva York, Estados Unidos el 14 de julio
de 2003 y firmado por J. Trevor Lumb, Vicepresidente de Pfizer Products Inc.

CERTIFICACION NOTARIAL

Bilingüe inglés- español, el 14 de julio de 2003 el suscrito notario Kenneth
Greenwood certifica que J. Trevor Lumb ejercía funciones de Vicepresidente de la
Compañía Pfizer Products Inc., con sede en Groton, Connecticut, Estados Unidos.

Firma del notario

Sello notarial: certificado, verificado y autenticado en la Localidad de Egham
en Surrey, 14 julio, 2003 por el Notario Kenneth Greenwood-Horne Engall & Freeman

Sello Notario Público en alto relieve rojo.

APOSTILLA

REINO UNIDO DE GRAN BRETAÑA E IRLANDA DEL NORTE

1. País :Reino Unido de Gran Bretaña e Irlanda del Norte

Este documento Público

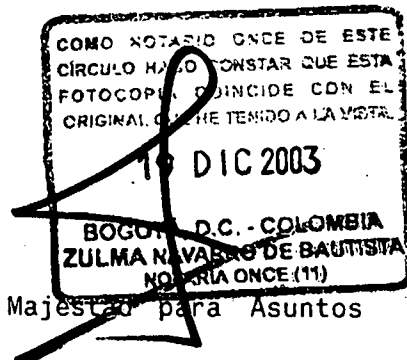
2. ha sido firmado por K. Greenwood
3. ejerce funciones de Notario Público
4. Lleva el sello de dicho Notario Público

CERTIFICADO

5. En Londres 6. El 17 de julio de 2003
7. Por el Secretario de Estado Principal de su Majestad para Asuntos
exteriores y de la mancomunidad
8. No. G210435
9. Sello del Secretario de Estado Principal de su Majestad para Asuntos
exteriores y de la mancomunidad
10. Firma de R. Bawden - Por Secretario de Estado

Si el documento se usa en un país que no es parte de la convención de la Haya del 5 de octubre 1961, debe
presentarse en sección consular de la misión que representa el país.

Es traducción fiel del inglés, con copia
confrontación. Bogotá 25 de julio-2003.



archivo para
Marlén Neira C.

MARLEN NEIRA CASTRO
Traductor e Intérprete Oficial
Inglés - Español - Inglés
Resolución No. 2117 del 7 Oct 1987

OLARTE RAISBECK

OLARTE RAISBECK & FRIERI, LTDA.
LEGAL & PROFESSIONAL SERVICES

WORLD TRADE CENTER — TORRE C
CALLE 100 NO. 8A-55 PISO 10
BOGOTA, COLOMBIA
TELEPHONE: +57-1 638-6200
FAX: +57-1 638-6201

www.olarteraisbeck.com

Power of Attorney

The undersigned,

domiciled in

Eastern Point Road, Groton, Connecticut 06340 USA

by means of these presents hereby grants to **Carlos R. Olarte, J. Ian Raisbeck and Ana María Frieri** full and sufficient Power of Attorney to file, prosecute, obtain, defend and enforce any and all of the company's **Patents, Utility Models and Industrial Designs** in the Republic of Colombia, to which end it empowers them to take all steps necessary before any administrative or judicial authority of any class for the objects stated, to file petitions, appeals, replies and oppositions, pay taxes and annuities, request testimonies, receive documents and securities, abandon applications and collect refunds. Sufficient power is hereby granted to receive notifications on behalf of the Company, to confer powers on those who are to represent the company judicially and extrajudicially, to answer in court in the matter of all claims and demands that may be presented in connection with the objects stated, giving them likewise power to substitute these presents and revoke such substitutions.

Signature/Firma:

Date/Fecha: July 14, 2003

City, Country/Ciudad, País: New York, USA

Poder

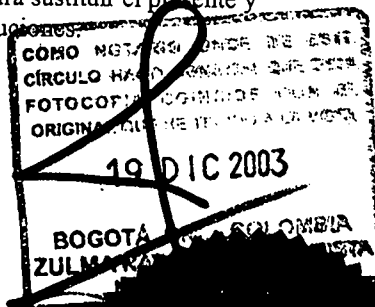
El suscrito,

Pfizer Products Inc.

domiciliado en

Eastern Point Road, Groton, Connecticut 06340 USA

por medio del presente otorga a **Carlos R. Olarte, J. Ian Raisbeck y Ana María Frieri** poder especial, amplio y suficiente para presentar, tramitar, obtener, defender y hacer respetar todas y cualquiera de **Patentes, Modelos de Utilidad y Diseños Industriales** de la compañía en la República de Colombia, a cuyo efecto los faculta para dar todos los pasos necesarios ante cualquier autoridad administrativa o judicial de cualquier jerarquía para cumplir con lo encomendado, elevar solicitudes, apelaciones, respuestas y oposiciones, pagar impuestos y anualidades, solicitar testimonios, recibir documentos y valores, desistir y percibir. Se concede poder bastante para recibir notificaciones a nombre de la compañía, otorgar poderes a quienes vayan a representar a la compañía judicial y extrajudicialmente, responder en juicio a todas las reclamaciones o demandas que por motivo de lo encomendado se presentaren, dándoles asimismo facultad para sustituir el presente y revocar dichas sustituciones.



OLARTE RAISBECK

OLARTE RAISBECK & FRIERI, LTDA.
LEGAL & PROFESSIONAL SERVICES

WORLD TRADE CENTER — TORRE C
CALLE 100 No. 8A-55 PISO 10
BOGOTA, COLOMBIA
TELEPHONE: +57-1 638-6200
FAX: +57-1 638-6201

www.olarteraisbeck.com

164
5/5

Notarial Certification

Certificación Notarial

On this date,
July 14, 2003

The undersigned Notary Public certifies:

1. That J. Trevor Lumb
of legal age and domiciled in
NEW YORK, USA
signed the foregoing document.

2. That the grantor has executed the foregoing
document as Vice President
of Pfizer Products Inc.

3. That Pfizer Products Inc.,
having its principal place of business located in
Groton, Connecticut, U.S.A.
is duly incorporated, is currently in existence, and
that the purposes for which the Power of Attorney is
granted are within the scope of its corporate
purposes.

4. That the grantor has the authority to execute the
Power of Attorney and that his/her representation is
legal.

5. The foundation for my certifications contained in
points 2, 3 and 4 was the exhibition of the following
authentic document(s):

En esta fecha,

el Notario Público suscrito certifica:

1. Que
J. Trevor Lumb
mayor de edad y domiciliado
New York
suscribió el documento que antecede.

2. Que el otorgante ha suscrito el referido
documento en su carácter de
de

4. Que
con sede principal ubicada en

está legalmente constituida, que tiene existencia
legal vigente y que los propósitos para los cuales
se otorga el poder se encuentra dentro de los que
comprenden su objeto social.

4. Que el otorgante tiene la representación para
suscribir el poder, y que ésta es legítima.

5. El fundamento de mis certificaciones
contenidas en los puntos 2, 3 y 4 fue la exhibición
de los (del) siguiente(s) documento(s) auténtico(s):

NOTARY PUBLIC (Signature):

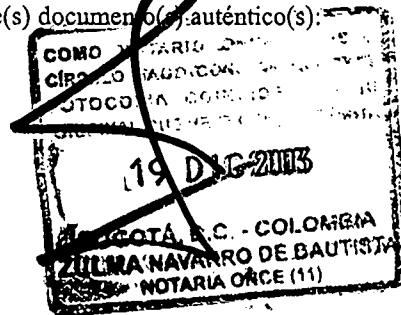
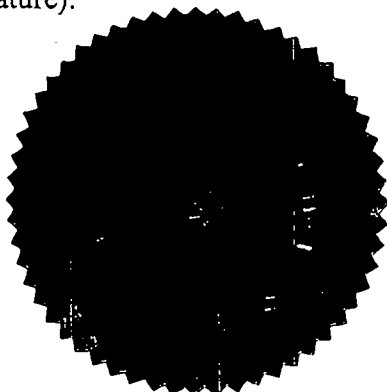
EXECUTION
Certified Verified and Authenticated
In The Town Of Egham In Surrey

This 14

Day Of

July
2003

KENNETH GREENWOOD
NOTARY PUBLIC
HORN ENOALL AND FREEMAN



APOSTILLE

(Hague Convention of 5 October 1961 / Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

UNITED KINGDOM OF GREAT BRITAIN AND NORTHERN IRELAND

1. Country: United Kingdom of Great Britain and Northern Ireland
Pays: Royaume-Uni de Grande-Bretagne et d'Irlande du Nord

This public document / Le présent acte public

2. Has been signed by **K Greenwood**
a été signé par
3. Acting in the capacity of **Notary Public**
agissant en qualité de
4. Bears the seal/stamp of **The Said Notary Public**
est revêtu du sceau/timbre de

5. at London/à Londres

Certified/Attesté
6. the/le 17 July 2003

7. by Her Majesty's Principal Secretary of State for Foreign and Commonwealth Affairs /
par le Secrétaire d'Etat Principal de Sa Majesté aux Affaires Etrangères et du Commonwealth.

8. Number/sous No **G210435**

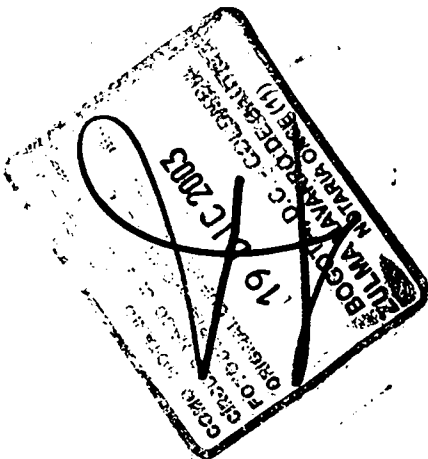
9. Stamp:
timbre:

10. Signature: **R. Bawden**



For the Secretary of State Pour le Secrétaire d'Etat

If this document is to be used in a country which is not party to the Hague Convention of 5 October 1961,
it should be presented to the consular section of the mission representing that country.



DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No. 03- 69212

**EL EXTRACTO DE LA PRESENTE SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION –
PCT, FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No 534,
DE FECHA 28 DE NOVIEMBRE DE 2003, EL TERMINO HABIL SEÑALADO
POR LA LEY EXPIRA EL 25 DE FEBRERO DE 2004.**

NOTA: Dentro del plazo de los seis (6) meses siguientes a partir de la fecha de publicación en la gaceta de Propiedad Industrial, deberá solicitar y cancelar el examen de patentabilidad so pena de que la solicitud caiga en abandono, de acuerdo con lo establecido en el Artículo 44 de la Decisión 486/2000.

SE PRESENTARON OPOSICIONES POR PARTE DE TERCEROS.

SI ☐ ☐

NO ☒ ☐

PCT

WORLD INTELLECTUAL PROPERTY ORGANIZATION
International Bureau

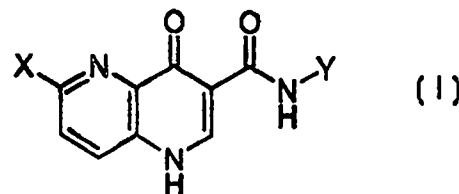
INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(51) International Patent Classification ⁶ : C07D 471/04, A61K 31/44 // (C07D 471/04, 221:00, 221:00)	A1	(11) International Publication Number: WO 99/10347 (43) International Publication Date: 4 March 1999 (04.03.99)
(21) International Application Number: PCT/US98/17513 (22) International Filing Date: 24 August 1998 (24.08.98) (30) Priority Data: 08/918,180 25 August 1997 (25.08.97) US (71) Applicant (for all designated States except US): NEUROGEN CORPORATION [US/US]; 35 N.E. Industrial Road, Branford, CT 06405 (US). (72) Inventors; and (75) Inventors/Applicants (for US only): ALBAUGH, Pamela [US/US]; 81 Long Hill Road, Clinton, CT 06413 (US). DeSIMONE, Robert, W. [US/US]; 37 Gina Drive, Durham, CT 06422 (US). LIU, Gang [CN/US]; 491 Pesaro Street, Agoura, CA 91301 (US). (74) Agent: SARUSSI, Steven, J.; McDonnell Boehnen Hulbert & Berghoff, Suite 3200, 300 South Wacker Drive, Chicago, IL 60606 (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 With international search report.

(54) Title: SUBSTITUTED 4-OXO-NAPHTHYRIDINE-3-CARBOXAMIDES AS GABA BRAIN RECEPTOR LIGANDS

(57) Abstract

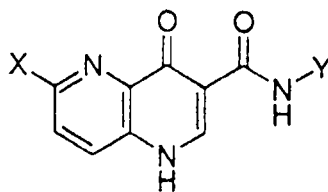
The present invention encompasses structures of Formula (I) or the pharmaceutically acceptable non-toxic salts thereof wherein: X is hydrogen, halogen, (un)substituted alkyl, (un)substituted alkoxy or amino; and Y is (un)substituted alkyl, aryl, or heteroaryl, which compounds are highly selective agonists, antagonists or inverse agonists for GABA_A brain receptors or prodrugs of agonists, antagonists or inverse agonists for GABA_A brain receptors. These compounds are useful in the diagnosis and treatment of anxiety, Down Syndrome, sleep, cognitive and seizure disorders, and overdose with benzodiazepine drugs and for enhancement of alertness.



SUMMARY OF THE INVENTION

This invention provides novel compounds of Formula I which interact with a GABA_A binding site, the benzodiazepine receptor.

5 The invention provides pharmaceutical compositions comprising compounds of Formula I. The invention also provides compounds useful in the diagnosis and treatment of anxiety, Down Syndrome, sleep, cognitive and seizure disorders, and overdose with benzodiazepine drugs and for
10 enhancement of alertness. Accordingly, a broad embodiment of the invention is directed to compounds of Formula I:



I

wherein:

15 X is hydrogen, halogen, -OR₁, C₁-C₆ alkyl optionally substituted with up to three groups selected independently from halogen and hydroxy, or -NR₂R₃;

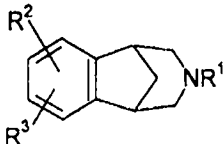
X is phenyl, naphthyl, 1-(5,6,7,8-tetrahydro)naphthyl or 4-(1,2-dihydro)indenyl, pyridinyl, pyrimidyl,
20 isoquinolinyl, 1,2,3,4-tetrahydroisoquinolinyl, benzofuranyl, benzothienyl, each of which is optionally substituted with up to three groups selected from halogen, C₁-C₆ alkyl, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₆ alkylthio,



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.		

5

ARYL FUSED AZAPOLYCYCLIC COMPOUNDSBackground 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.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
✓ **CARLOS R. OLARTE**

ASUNTO	Radicación	03-69212
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio	Nº 9 4 8 7
	Folios	8

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Vía Nacional	☐		
Vía PCT (fase nacional)	☒	Cap. I	☐
		Cap. II	☒

No. Sol. Internacional	PCT/IB02/00515
Fecha de Presentación Internal.	20-02-2002

Como resultado del examen de fondo, realizado con fundamento en el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

1. Documentos estudiados

- | | | | |
|------|--------------------------|--|-------------------------------|
| 1.1. | <u>Descripción:</u> | Folios: 60 a 126 | (como se radicó inicialmente) |
| 1.2. | <u>Reivindicaciones:</u> | Folios 127 a 145 | (como se radicó inicialmente) |
| 1.3. | <u>Prioridad:</u> | Folio: 1 y 14 | |
| | | Fecha: 01-03-2001; país y número: US 60/272.566. | |

2. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "USO DE AGONISTAS INVERSOS DE GABA_A EN COMBINACION CON AGONISTAS PARCIALES DEL RECEPTOR DE NICOTINA, ESTROGENOS, MODULADORES SELECTIVOS DE ESTROGENOS O VITMINA E, PARA EL TRATAMIENTO DE TRASTORNOS COGNITIVOS".

El objeto de la p^resente solicitud de patente de invención consiste en composiciones farmacéuticas para la prevención y/o el tratamiento de enfermedades.

Reivindicaciones 1– 11: Una composición farmacéutica

Reivindicación 12-15: Procedimiento de tratamiento para el trastorno cognitivo.

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de composiciones útiles para tratar un trastorno que implica una disfunción cognitiva.

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio proporciona una composición que contiene un agonista inverso de GABA_A y un agonista parcial del receptor de nicotina, un agente estrogénico, un modulador selectivo del receptor de estrógenos (SERM), o vitamina E.

La invención se catalogó según la Clasificación Internacional de Patentes (IPC.) como: A61 K 31/00.

3. De la solicitud de Patente

3.1. Descripción (artículo 28 D. 486)

La solicitud no presenta resultados que permitan reconocer o evaluar las ventajas de las composiciones presentadas frente a las composiciones conocidas en el estado de la técnica útiles para solucionar el mismo problema técnico, o que permitan determinar cual o cuales de las composiciones propuesta es la mas ventajosa o que cuál es el efecto inesperado que se logra con estas combinaciones.

Por lo anterior, la descripción no cumple con el requisito de divulgación completa lo que haría difícil su comprensión y ejecución de acuerdo al art. 28 de la Decisión 486 o art. 22 del Tratado PCT.)

3.2. Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

La reivindicación 1 carece de concisión ya que no delimita las composiciones que se desean proteger, no establece cuál agonista inverso del receptor GABA_A es el mas adecuado, ni cuales agonistas del receptor de nicotina, estrógenos o agonistas parciales del receptor de estrógenos se va a utilizar en la presente solicitud. Por lo tanto la reivindicación presenta un elevado número de composiciones cuya utilidad no se encuentra soportada por la solicitud.

El capítulo reivindicatorio utiliza las expresiones "eficacia funcional", "eficacia media", "potencia funcional" y "Ki de unión"; dichas expresiones y sus valores no se consideran características técnica esenciales de una composición y a su vez le restan claridad a la misma.

La reivindicación 8 utiliza las expresiones "grupo heterocíclico" y "fenilo opcionalmente sustituido", dichas expresiones le restan concisión a la solicitud ya que no permiten delimitar el alcance de la materia incluyendo compuestos que no se encuentran soportados por la descripción.

Por lo anterior, las reivindicaciones mencionadas no cumplen con el requisito de definición, claridad, concisión o sustento por la descripción de acuerdo al art. 30 de la Decisión 486.y/o art.22 Tratado PCT.

4. Excepción a la patentabilidad (artículo 20 D486 literal d)

Las reivindicaciones 12 a 15 establecen un procedimiento para el tratamiento de trastornos cognitivos. Los métodos de tratamiento no son objeto de patente.

5. Determinación del Estado de la Técnica

Fecha de presentación de la solicitud prioritaria 1-03-2001

Teniendo en cuenta la fecha indicada se realizó la búsqueda en el estado de la técnica de documentos relacionados con la solicitud encontrándose los siguientes documentos más relevantes:

Nº	Documento	Título	Fecha de publicación*
D1	WO99/10347	SUBSTITUTED 4-OXO-NAPHTHYRIDINE-3-CARBOXAMIDES AS GABA BRAIN RECEPTOR LIGANDS	04-03-1999
D2	WO99/35131	ARYL FUSED AZAPOLYCYCLIC COMPOUNDS	15-07-1999
D3			

6. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

6.1. Nivel inventivo (artículo 18 D486)

El documento del Estado de la Técnica más próximo es D1 que enseña composiciones que contienen una agente agonista inverso GABA_A (Ver folios: 166-167), que son útiles para tratar desórdenes cognitivos.

La única diferencia con D1 es que esta solicitud menciona que la composición puede contener adicionalmente NRPA, estrógenos, moduladores selectivos de estrógenos o vitamina E. Pero estas no parecen conceder un efecto técnico inesperado ya que es conocida la utilidad del NRPA para el tratamiento de desordenes cognitivos y simplemente se trata de una terapia conjugada. Adicionalmente, el solicitante no presenta resultados que permitan evidenciar la ventaja técnica de dichas combinaciones.

El problema técnico planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de composiciones útiles para tratar un trastorno que implica una disfunción cognitiva. Este problema se había resuelto previamente mediante el mismo tipo de composiciones conocidas que contienen un agonista inverso de GABA_A. Por esta razón se considera que adicionar otro compuesto como un NRPA que también es útil para tratar la disfunción cognitiva, no aporta ningún avance sorprendente al estado de la técnica.

Además, puesto que tanto D1 como D2 divulgaban previamente (folios: 167 y) composiciones útiles para tratar los trastornos cognitivos y D2 establece algunos de los compuestos que son utilizados en las composiciones de esta solicitud, una persona conocedora de la materia motivada por tal sugerencia lograría las composiciones que aquí se presente; de manera que para una persona medianamente versada en la materia sería obvio combinar dos compuestos que se sabe son útiles para tratar desordenes cognitivos y reunirlos en una misma composición. Por lo cual las composiciones de las reivindicaciones 1 a 11 no poseen Nivel Inventivo.

7. Conclusión:

Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

Nº	Documento Nº	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO99/10347	1-11	Nivel Inventivo
D2	WO99/35131	1-11	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 sesenta días contados a partir de la fecha de 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 quinto del título primero de la Circular Única N° 10 de 2001.

ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de División de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha
18 JUL. 2008

CONCEPTO TÉCNICO No.1310	EXAMINADOR TÉCNICO Código No. 202073
------------------------------------	--

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCION **Nº 4 4 7 3 6**

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. PCT/03-69212

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las que se confirieron en el artículo 4, numeral 5 del decreto 2153 de 1992, y

CONSIDERANDO:

PRIMERO: Que mediante escrito radicado en esta Superintendencia el 12 de agosto del 2003 bajo el número 03069212, se presentó la solicitud de patente de invención titulada "USO DE AGONISTAS INVERSOS DE GABA_A EN COMBINACION CON AGONISTAS PARCIALES DEL RECEPTOR DE NICOTINA, ESTROGENOS, MODULADORES SELECTIVOS DE ESTROGENOS O VITAMINA E, PARA EL TRATAMIENTO DE TRASTORNOS COGNITIVOS", para los efectos de que se dé comienzo a la fase nacional, en virtud del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT).

SEGUNDO: Que efectuado el examen de forma en cuanto a los requisitos que debe llenar la solicitud y cumplidas las exigencias legales, se ordenó publicar el extracto sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece que: *"Si la oficina nacional competente encontrara que la invención no es patentable o que no cumple con alguno de los requisitos establecidos en esta Decisión para la concesión de la patente, lo notificará al solicitante. Este deberá responder a la notificación dentro del plazo de sesenta días contados a partir de la fecha de la notificación. Este plazo podrá ser prorrogado por una sola vez por un período de treinta días adicionales.(...) Si el solicitante no respondiera a la notificación dentro del plazo señalado, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, la oficina nacional competente denegará la patente"*.

CUARTO: Que realizado el examen de fondo, se requirió al solicitante en los términos del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, para que presentara respuesta a las observaciones de carácter técnico visibles a folios 166 a 173 del cuaderno administrativo, relacionadas con la patentabilidad o cumplimiento de los requisitos establecidos por esta Decisión para la concesión de la patente. Frente a dicho requerimiento no hubo pronunciamiento alguno por parte del mismo, por lo cual es procedente negar el privilegio de patente solicitado con fundamento en lo dispuesto en el artículo 45 de la Decisión 486.

RESUELVE:

ARTICULO PRIMERO: Negar el privilegio de patente de invención para la solicitud

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCION **Nº 4 4 7 3 6**

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. PCT/03-69212

correspondiente a "USO DE AGONISTAS INVERSOS DE GABA_A EN COMBINACION CON AGONISTAS PARCIALES DEL RECEPTOR DE NICOTINA, ESTROGENOS, MODULADORES SELECTIVOS DE ESTROGENOS O VITAMINA E, PARA EL TRATAMIENTO DE TRASTORNOS COGNITIVOS", que entró en fase nacional en virtud del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT).

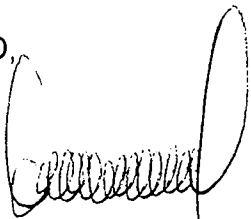
ARTICULO SEGUNDO: Notificar personalmente el contenido de la presente resolución al doctor Carlos Reinaldo Olarte García, o a quien haga sus veces, en su calidad de apoderado de Pfizer Products Inc., entregándole copia de la misma, advirtiéndole que contra ella procede el recurso de reposición interpuesto 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 OCT. 2008

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,


GUSTAVO VALBUENA QUIÑONES

Doctor
CARLOS REINALDO OLARTE GARCIA
Calle 100 N° 8 A – 37, Piso 10.
World Trade Center – Torre A.
Bogotá D.C.

202021

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
EL SECRETARIO GENERAL ad - hoc

que la resolución 44736 de fecha: 3/ oct 08
Estado número 190

Ajudo el 12 Nov 08

el 26 Nov 08