



No. 05-098900-00003-0000

Fecha: 2007-08-17 16:54:27 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eva: 379 FASENACIONALII
Act. 538 PETICION Folios: 2

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

Ref: Expediente No. 05-098.900

Solicitud de patente de invención titulada: "FORMAS DE DOSIFICACION Y
PROCEDIMIENTO DE TRATAMIENTO QUE USAN INHIBIDORES DEL VEGFR".

Solicitante: PFIZER INC.

**SOLICITUD DE EXAMEN DE PATENTABILIDAD SEGÚN
EL ARTÍCULO 44 DE LA DECISION 486, GACETA No. 578**

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, 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 \$202.000 pesos para cubrir la tasa correspondiente, según la Resolución 36155 del año 2006.

Atentamente,

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

Anexo: Recibo por \$202.000 pesos

LMB/P2005/ 000127 070816

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No 05-098900-00003-0000

Fecha: 15/08/2007 Dep: 2020 NUECREACIONE
Tra: 11 PATENTE(IY) Eje: 379 FASENACIONALII
Act: 538 PETICION Folios: 2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 65,772
FECHA : AGOSTO 15 DE 2007

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
OLARTE RAISDEX	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	090-00110-6	48287833	15/08/2007	3,220,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	
		344 PTC CAP-II EXAMEN DE PATENTABILIDAD	202,000.00
		TOTAL :	\$ 202,000.00

SON: DOSCIENTOS DOS MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No 05-98900

EL EXTRACTO DE LA PRESENTE SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION

FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No 578 DE

FECHA 31 DE JULIO DEL 2007, EL TERMINO HABIL SEÑALADO POR LA

LEY EXPIRA EL 26 DE OCTUBRE DEL 2007

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 ☒

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
11 January 2001 (11.01.2001)

PCT

(10) International Publication Number
WO 01/02369 A2

(51) International Patent Classification⁷: C07D 231/00

(21) International Application Number: PCT/US00/18263

(22) International Filing Date: 30 June 2000 (30.06.2000)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
60/142,130 2 July 1999 (02.07.1999) US

(71) Applicant: AGOURON PHARMACEUTICALS, INC.
[US/US]; 10350 North Torrey Pines Road, La Jolla, CA
92037-1020 (US).

(72) Inventors: KANIA, Robert, Steven; 4284 Corte Favor,
San Diego, CA 92130 (US). BENDER, Steven, Lee; 915
Reese Street, Oceanside, CA 92130 (US). BORCHARDT,
Allen, J.; 5419 Via Carancho, San Diego, CA 92111 (US).
BRAGANZA, John, F.; 3145 Cowley Way #134, San
Diego, CA 92117 (US). CRIPPS, Stephan, James; 11056
Pallon Way, San Diego, CA 92124 (US). HUA, Ye; 8671
Via Marllorca #46, La Jolla, CA 92037 (US). JOHNSON,
Michael, David; 4776 Del Mar Avenue, San Diego, CA
92017 (US). JOHNSON, Theodore, Otto, Jr.; 3612
Torrey View Court, San Diego, CA 92130 (US). LUU,
Hiep, The; 10330 Penrod Lane, San Diego, CA 92126
(US). PALMER, Cynthia, Louise; 9847 Ogram Drive,
San Diego, CA 91941 (US). REICH, Siegfried, Heinz;
311 Glenmont Drive, Solana Beach, CA 92075 (US).
TEMPCZYK-RUSSELL, Anna, Maria; 4785 Caminito

Borrego, San Diego, CA 92130 (US). TENG, Min; 5185
Seachase Street, San Diego, CA 92130 (US). THOMAS,
Christine; 3550 Lebon Drive #6415, San Diego, CA
92122 (US). VARNEY, Michael, David; 738 Barbara
Avenue, Solana Beach, CA 92075 (US). WALLACE,
Michael, Brennan; 7532 Charmant Drive #311, San
Diego, CA 92122 (US).

(74) Agents: PINO, Mark, J.; Shanks & Herbert, TransPo-
tomac Plaza, 1033 North Fairfax Street, Suite 306, Alexan-
dria, VA 22314 et al. (US).

(81) Designated States (*national*): AE, AG, AL, AM, AT, AU,
AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE,
DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ,
PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT,
TZ, UA, UG, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(84) Designated States (*regional*): ARIPO patent (GH, GM,
KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, 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:

— Without international search report and to be republished
upon receipt of that report.

For two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guid-
ance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the begin-
ning of each regular issue of the PCT Gazette.

(54) Title: INDAZOLE COMPOUNDS AND PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS FOR INHIBITING PROTEIN KINASES,
AND METHODS FOR THEIR USE

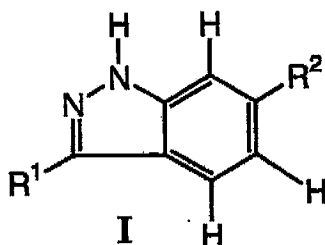
(57) Abstract: Indazole compounds that modulate and/or inhibit the activity of certain protein kinases are described. These com-
pounds and pharmaceutical compositions containing them are capable of mediating tyrosine kinase signal transduction and thereby
modulate and/or inhibit unwanted cell proliferation. The invention is also directed to the therapeutic or prophylactic use of phar-
maceutical compositions containing such compounds, and to methods of treating cancer and other disease states associated with
unwanted angiogenesis and/or cellular proliferation, such as diabetic retinopathy, neovascular glaucoma, rheumatoid arthritis, and
psoriasis, by administering effective amounts of such compounds.

WO 01/02369 A2

116
116CLAIMS

What is claimed is:

1. A compound of the Formula I:



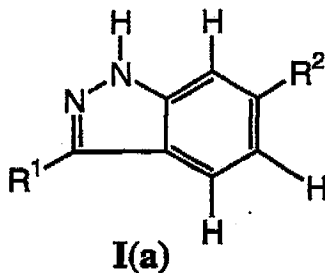
5 wherein:

R¹ is a substituted or unsubstituted aryl or heteroaryl, or a group of the formula CH=CH—R³ or CH=N—R³ where R³ is a substituted or unsubstituted alkyl, alkenyl, cycloalkyl, heterocycloalkyl, aryl, or heteroaryl; and

R² is a substituted or unsubstituted aryl, heteroaryl, or Y-X, where Y is O,
10 S, C=CH₂, C=O, S=O, SO₂, alkylidene, NH, or N-(C₁-C₈ alkyl), and X is substituted or unsubstituted Ar, heteroaryl, NH-(alkyl), NH-(cycloalkyl), NH-(heterocycloalkyl), NH(aryl), NH(heteroaryl), NH-(alkoxyl), or NH-(dialkylamide), where Ar is aryl;

or a pharmaceutically acceptable prodrug, pharmaceutically active
15 metabolite, or pharmaceutically acceptable salt thereof.

2. A compound of the Formula I(a):



wherein:

117/147

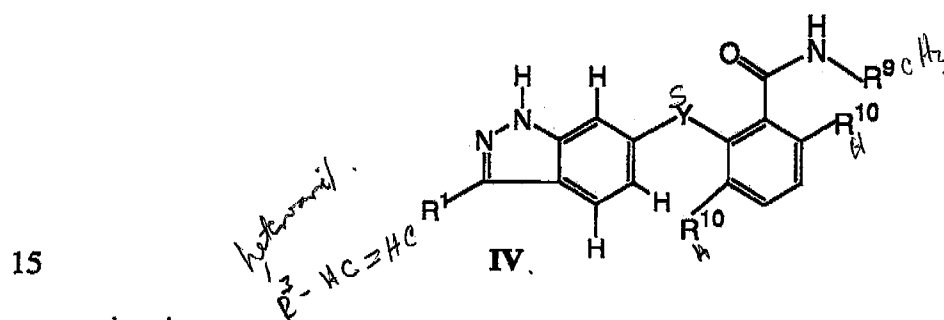
8. A compound, pharmaceutically acceptable prodrug,
pharmaceutically active metabolite, or pharmaceutically acceptable salt according
to claim 7, wherein:

R^1 is a substituted or unsubstituted bicyclic heteroaryl, or a group of the
5 formula $CH=CH-R^3$ where R^3 is a substituted or unsubstituted aryl or heteroaryl;
 Y is O, S, $C=CH_2$, $C=O$, NH, or $N-(C_1-C_8 \text{ alkyl})$; and
 R^8 is a substituted or unsubstituted aryl, heteroaryl, alkyl, or alkenyl.

9. A compound, pharmaceutically acceptable prodrug,
pharmaceutically active metabolite, or pharmaceutically acceptable salt according
10 to claim 7, wherein:

R^1 is $CH=CH-R^3$, where R^3 is a substituted or unsubstituted aryl group;
 Y is O or S; and
 R^8 is a substituted or unsubstituted aryl or heteroaryl.

10. A compound of the Formula IV:



wherein:

R^1 is a substituted or unsubstituted aryl or heteroaryl, or a group of the
formula $CH=CH-R^3$ or $CH=N-R^3$, where R^3 is a substituted or unsubstituted
alkyl, cycloalkyl, heterocycloalkyl, aryl, or heteroaryl;

20 Y is O, S, $C=CH_2$, $C=O$, $S=O$, SO_2 , CH_2 , $CHCH_3$, NH, or $N-(C_1-C_8 \text{ alkyl})$;

119/18

R^9 is a substituted or unsubstituted alkyl, cycloalkyl, heterocycloalkyl, aryl, heteroaryl, alkoxyl, aryloxy, cycloalkoxyl, $NH-(C_1-C_8 \text{ alkyl})$, $NH-(\text{aryl})$, $NH-(\text{heteroaryl})$, $N=CH-(\text{alkyl})$, $NH(C=O)R^{11}$, or NH_2 , where R^{11} is independently selected from hydrogen, substituted or unsubstituted alkyl, cycloalkyl,

5 heterocycloalkyl, aryl, and heteroaryl; and

R^{10} is independently selected from hydrogen, halogen, and lower-alkyl; or a pharmaceutically acceptable prodrug, pharmaceutically active metabolite, or pharmaceutically acceptable salt thereof.

11. A compound, pharmaceutically acceptable prodrug,
10 pharmaceutically active metabolite, or pharmaceutically acceptable salt according to claim 10, wherein:

R^1 is a group of the formula $CH=CH-R^3$ where R^3 is a substituted or unsubstituted aryl or heteroaryl;

Y is S or NH; and

15 R^9 is a substituted or unsubstituted alkyl, alkoxyl, or $NH-(\text{heteroaryl})$.

12. A compound, pharmaceutically acceptable prodrug,
pharmaceutically active metabolite, or pharmaceutically acceptable salt, selected
from:

20

119
49

13. A pharmaceutical composition comprising:

(a) a therapeutically effective amount of a compound,
pharmaceutically acceptable prodrug, pharmaceutically active metabolite, or
pharmaceutically acceptable salt of claim 1; and

5 (b) a pharmaceutically acceptable carrier, diluent, or vehicle therefor.

14. A method of treating a mammalian disease condition mediated by
protein kinase activity, comprising administering to a mammal in need thereof a
therapeutically effective amount of a compound, pharmaceutically acceptable
prodrug, pharmaceutically active metabolite, or pharmaceutically acceptable salt
10 as defined in claim 1.

15. A method according to claim 14, wherein the mammalian disease
condition is associated with tumor growth, cell proliferation, or angiogenesis.

16. A method of modulating the activity of a protein kinase receptor,
comprising contacting the kinase receptor with an effective amount of a
15 compound, pharmaceutically acceptable prodrug, pharmaceutically active
metabolite, or pharmaceutically acceptable salt as defined in claim 1.

17. A method according to claim 16, wherein the protein kinase
receptor is a VEGF receptor.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.

Abogado
CARLOS OLARTE

ASUNTO	Radicación	05098900
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	411
	Oficio	10935
	Folios	008

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Vía Nacional	☐		
Vía PCT (fase nacional)	☒	Cap. I	☐ Cap. II
No. Sol. Internacional		PCT/IB2004/000867	
Fecha de Presentación Internal.	Marzo 17, 2004		

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: 24 a 76 | (como se radicó inicialmente) |
| 1.2. | <u>Reivindicaciones:</u> | Folios: 77 a 80 | (como se radicó inicialmente) |
| 1.3. | <u>Prioridad:</u> | Abril/03/2003, US, 60/460,695
Julio/31/2003, US, 60/491,771 | |

2. Objeto de la invención

Título de la solicitud: **FORMAS DE DOSIFICACIÓN Y PROCEDIMIENTO DE TRATAMIENTO QUE USAN INHIBIDORES DEL VEGFR.**

El objeto de la presente solicitud de patente de invención consiste en:

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCION **Nº 5 5 2 3 6**

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. PCT/05-98900

correspondiente a "FORMAS DE DOSIFICACION Y PROCEDIMIENTO DE TRATAMIENTO QUE USAN INHIBIDORES DEL VEGFR", que entró en fase nacional en virtud del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT).

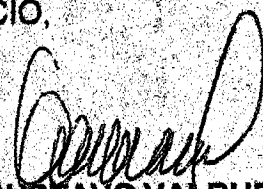
ARTICULO SEGUNDO: Notificar personalmente el contenido de la presente resolución al doctor Carlos Reinaldo Olarte García, en su calidad de apoderado de Pfizer Inc., o a quien haga sus veces, entregándole copia de la misma, advirtiéndole que contra ella procede el recurso de reposición interpuesto ante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

24 DIC. 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