

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. S. D.

Re: P1.-ASTRAZENECA AB.- Solicitud de Patente de Invención en Fase Nacional PCT para "LIGANDOS DEL RECEPTOR NICOTÍNICO DE ACETILCOLINA 101".-Clase C07D 491/22.-Expediente número 08-116.894.-

1. Me refiero a mi memorial de 16 de Diciembre de 2008.
2. Debidamente autorizado por mi representado, me permito manifestar a ese Despacho que es deseo del solicitante presentar en forma voluntaria un nuevo capítulo reivindicatorio que reemplaza al originalmente presentado, el cual consta de 15 reivindicaciones. Este capítulo tiene base el capítulo originalmente presentado, sobre el cual se han realizado las siguientes modificaciones:
 - (a) Reivindicaciones 1 y 2: Corresponden a las reivindicaciones originales 1 y 2.
 - (b) Nueva Reivindicación 3: "Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, con la condición de que cuando el fragmento es furilo, al menos uno de R^1 y R^2 no es hidrógeno." Esta reivindicación encuentra sustento en la reivindicación original 2 y en la página 7 de la descripción.
 - (c) Reivindicaciones 4 y 5: Corresponden a las reivindicaciones originales 4 y 5.
 - (d) Nueva Reivindicación 6: Se eliminaron los fragmentos de fórmula II y III. Esta reivindicación encuentra sustento en la reivindicación original

6 original.

(e) Nueva Reivindicación 7: Se eliminó el fragmento de fórmula II. Esta reivindicación se encuentra sustentado en la reivindicación original 7.

(f) Nueva Reivindicación 8: Se incluyó el fragmento de fórmula III y se cambió la definición de R^1 y R^2 de la siguiente manera: " R^1 y R^2 junto con el nitrógeno al que están unidos forman un heterociclo seleccionado de pirrolidinilo, piperidinilo, piperazinilo o morfolinilo". Esta reivindicación encuentra sustentado en las reivindicaciones originales 1, 2, 5 y 8.

(g) Nueva Reivindicación 9: "Un compuesto seleccionado del grupo que consiste de:

N,N-dimetil-1-{5-[(2R)-3'H-espiro[4-azabicyclo[2.2.2]octano-2,2'-furo[2,3-b]piridin]-5'-il]-2-tienil}metenamina;

N,N-dimetil-1-{4-[(2R)-3'H-espiro[4-azabicyclo[2.2.2]octano-2,2'-furo[2,3-b]piridin]-5'-il]-2-tienil}metenamina;

N-metil-1-{5-[(2R)-3'H-espiro[4-azabicyclo[2.2.2]octano-2,2'-furo[2,3-b]piridin]-5'-il]-2-tienil}metenamina;

1-{5-[(2R)-3'H-espiro[4-azabicyclo[2.2.2]octano-2,2'-furo[2,3-b]piridin]-5'-il]-2-tienil}metenamina, y

1-{4-[(2R)-3'H-espiro[4-azabicyclo[2.2.2]octano-2,2'-furo[2,3-b]piridin]-5'-il]-2-furil} metenamina;

o un esteroisómero, enantiómero, precursor hidrolizable in vivo o sal farmacéuticamente aceptable de cualquiera de los compuestos anteriores". Esta reivindicación encuentra sustentado en la reivindicación original 10.

(h) Nueva Reivindicación 10: Se eliminaron los compuestos

N,N-dimetil-1-{5-[(2R)-3'H-espiro[4-azabicyclo[2.2.2]octano-2,2'-furo[2,3-b]piridin]-5'-il]-2-tienil}metenamina;

N,N-dimetil-1-{4-[(2R)-3'H-espiro[4-azabicyclo[2.2.2]octano-2,2'-furo[2,3-b]piridin]-5'-il]-2-tienil}metenamina;

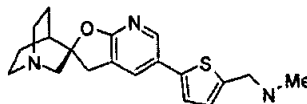
N-metil-1-{5-[(2R)-3'H-espiro[4-azabicyclo[2.2.2]octano-2,2'-furo[2,3-b]piridin]-5'-il]-2-tienil}metenamina;

1-{5-[(2R)-3'H-espiro[4-azabicyclo[2.2.2]octano-2,2'-furo[2,3-b]piridin]-5'-il]-2-tienil}metenamina, y

1-{4-[(2R)-3'H-espiro[4-azabicyclo[2.2.2]octano-2,2'-furo[2,3-b]piridin]-5'-il]-2-furil} metenamina.

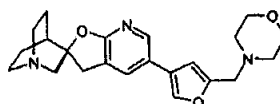
Esta reivindicación encuentra sustento en la reivindicación original 10.

- (i) Nueva Reivindicación 11: "Un compuesto de fórmula



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo". Esta reivindicación encuentra sustento en el Ejemplo 5, página 27 de la descripción.

- (j) Nueva Reivindicación 12: "Un compuesto de fórmula



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo". Esta reivindicación encuentra sustento en el Ejemplo 11, página 30 de la descripción.

- (k) Nueva Reivindicación 13: Corresponde a la reivindicación original 16.

- (l) Nueva Reivindicación 14: Corresponde a la reivindicación original 22.

- (m) Nueva Reivindicación 15: Corresponde a la reivindicación original 23.

En relación con la anterior modificación, atentamente me permito manifestar a ese Despacho que la misma **no amplía** de ninguna manera el alcance de la presente invención y que el nuevo capítulo modificado es el que debe ser tenido en cuenta en el trámite de Fase Nacional.

3. Anexo me permito presentar:

- (a) Formulario único de modificaciones y correcciones;
- (b) Recibo No. 09-29,463, expedido por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago de la tasa de modificación;
- (c) Copia de las páginas 35 a 40 que corresponden al nuevo capítulo reivindicatorio que consta de 15 reivindicaciones.



LLORED & CIA. S. A.

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

Señor Superintendente,


ALICIA LLORED & CIA. S. A.

T.P. 53.215

NOTARIA 41 DEL CÍRCULO DE BOGOTÁ D.C.
DEPARTAMENTO DE QUINDÍO
REPUBLICA DE COLOMBIA

El Notario 41 del círculo de Bogotá, da fe de que compareció personalmente: Alicia Lloreda Ricaurte identificada (o) con: 39.690.713 y tarjeta profesional de abogado No. 53215 del Consejo Superior de la Judicatura, quien autentica la firma puesta por ella (el) mismo en este escrito.

(Art. 84 C. P. C. Decreto. 2232/89 mod. 36)

Bogotá D.C. 11 MAYO 2009


ALICIA LLORED & CIA. S. A. AGENCIA

C.C. No. 39.690.713 de Usaquén



FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES.
2000-10

①

SOLICITUD DE:

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Solicitud.

②

SOLICITANTE

Nombre: ASTRAZENECA AB, sociedad existente y organizada de conformidad con las leyes de Suecia.

Dirección: SE-151 85 Södertälje, Suecia.

Teléfono: 3 264270

Fax: 6 069701

E-mail: jllcco@lloredacamacho.com

Domicilio: Södertälje, Suecia.

IDENTIFICACION

C.C. ☐

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Número _____

③

**REPRESENTANTE
O APODERADO**

Nombre: ALICIA LLOREDA RICAURTE

Dirección: Calle 72 No. 5-83 5° Piso

Teléfono: 3 264270

Fax: 6 069701

E-mail: jllcco@lloredacamacho.com

IDENTIFICACION

C.C. ☒

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Número _____ TP _____

④

Número de expediente:

08-116.894

⑤

Descripción de la corrección o modificación solicitada Nuevo Capítulo Reivindicatorio que consta de 15 reivindicaciones en la solicitud de patente de invención arriba referida.

⑥

Comprobante de pago No. 09-29,463

Fecha Abril 20 de 2009

⑦

Anexos:

☒

Comprobante de pago de la tasa.

☐

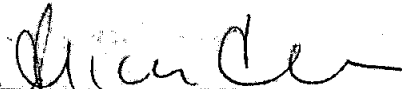
Poderes, si fuere el caso

☐

Certificado de existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.

⑧

NOMBRE ALICIA LLOREDA RICAURTE

FIRMA 

C.C. 39.690.713

53.215

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-116894- -00002-0000

Fecha: 2009-05-29 17:26:22 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 12

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 29,463
FECHA : ABRIL 20 DE 2009

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
LLOREDA Y CIA S. A	RECIBO DE CAJA			29452	20/04/2009	1,390,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-03 CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	12 MARCAS Y LEMAS COMERCIALES	111,000.00
	TOTAL :	\$ 111,000.00

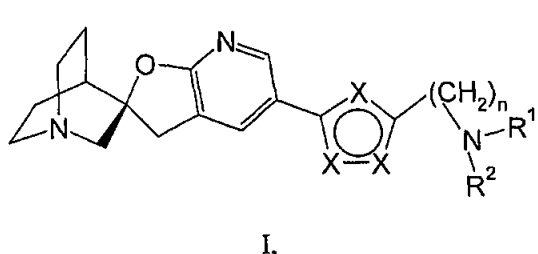
SON: CIENTO ONCE MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de acuerdo con la Fórmula I:



en donde:

- 5 X se selecciona independientemente en cada ocurrencia de CH, O, S, N o NH y al menos un X se selecciona de O, S, N o NH y no más de un X es O o S;

n es 0, 1, 2, ó 3, y

- 10 R^1 y R^2 se seleccionan independientemente de hidrógeno, -alquilo C_{1-6} , -cicloalquilo C_{3-7} , -alquenilo C_{2-6} , -alquinilo C_{2-6} , $-CF_3$, $-CONR^3R^4$, $-CH_2NR^3R^4$ o $-CH_2OR^3$;

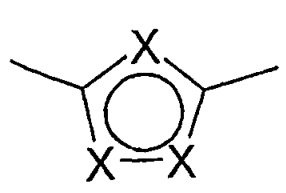
- 15 o, R^1 y R^2 junto con el nitrógeno al que están unidos forman un anillo heteroaromático de 5- o 6- miembros que tiene como átomos del anillo 1, 2 ó 3 heteroátomos seleccionados de nitrógeno, oxígeno y azufre, o un anillo heterocíclico de 5- o 6-miembros que tiene como átomos del anillo 1, 2 ó 3 heteroátomos seleccionados de nitrógeno, oxígeno y azufre;

R^3 y R^4 se seleccionan independientemente en cada ocurrencia de hidrógeno o -alquilo C_{1-4} , y

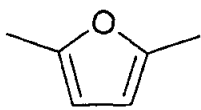
- 20 donde cualquier fragmento alquilo, cicloalquilo, alquenilo o alquinilo puede estar sustituido con 1, 2, 3 o más fragmentos halógeno, $-OH$ o $=O$ si es químicamente posible,

o un esteroisómero, enantiómero, precursor hidrolizable *in vivo* o sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

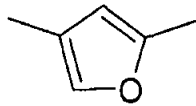
2. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde el fragmento



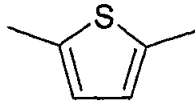
se selecciona de los fragmentos de Fórmulas II, III, IV, V o VI



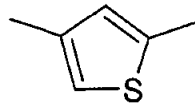
II



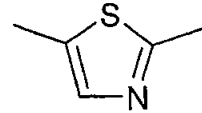
III



IV



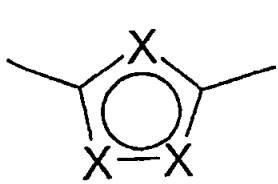
V



VI;

o un esteroisómero, enantiómero, precursor hidrolizable *in vivo* o sal
5 farmacéuticamente aceptable del mismo.

3. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, con la condición de que
cuando el fragmento

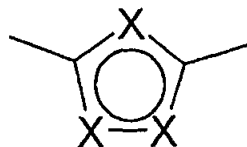


es furilo, al menos uno de R¹ y R² no es hidrógeno.

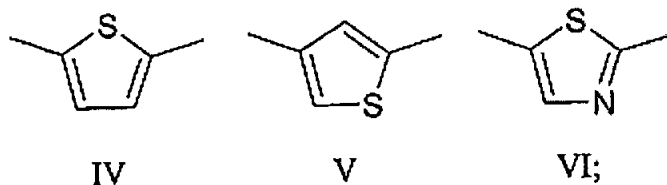
4. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde n es 1 ó 2; o un
10 esteroisómero, enantiómero, precursor hidrolizable *in vivo* o sal
farmacéuticamente aceptable del mismo.

5. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde R¹ y R² junto con
el nitrógeno al que están unidos se seleccionan de pirrolidinilo, piperidinilo,
piperazinilo o morfolinilo; o un esteroisómero, enantiómero, precursor hidrolizable
15 *in vivo* o sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

6. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde el fragmento



se selecciona de los fragmentos de Fórmulas IV, V o VI,

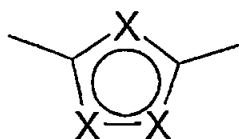


R^1 y R^2 se seleccionan independientemente de hidrógeno o metilo, y

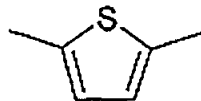
n es 1 ó 2; o un esteroisómero, enantiómero, precursor hidrolizable *in vivo* o sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

- 5 7. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde:

el fragmento



es un fragmento de Fórmula IV,



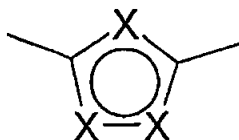
IV

; y

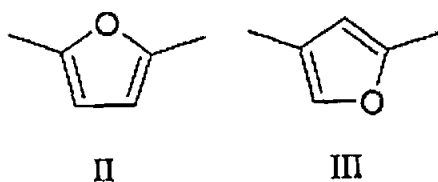
- 10 R^1 y R^2 se seleccionan independientemente de hidrógeno o metilo, y n es 1 ó 2.

8. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde:

el fragmento



es de Fórmula II o III,



R^1 y R^2 junto con el nitrógeno al que están unidos forman un heterociclo seleccionado de pirrolidinilo, piperidinilo, piperazinilo o morfolinilo.

9. Un compuesto seleccionado del grupo que consiste de

- 5 N,N-dimetil-1-{5-[(2R)-3'H-espiro[4-azabicyclo[2.2.2]octano-2,2'-furo[2,3-b]piridin]-5'-il]-2-tienil}metenamina;

N,N-dimetil-1-{4-[(2R)-3'H-espiro[4-azabicyclo[2.2.2]octano-2,2'-furo[2,3-b]piridin]-5'-il]-2-tienil}metenamina;

- 10 **N-metil-1-{5-[(2R)-3'H-espiro[4-azabicyclo[2.2.2]octano-2,2'-furo[2,3-b]piridin]-5'-il]-2-tienil}metanamina;**

1-{5-[(2R)-3'H-espiro[4-azabicyclo[2.2.2]octano-2,2'-furo[2,3-b]piridin]-5'-il]-2-tienil}metenamina, y

1-{4-[(2R)-3'H-espiro[4-azabicyclo[2.2.2]octano-2,2'-furo[2,3-b]piridin]-5'-il]-2-furil}metenamina;

- 15 o un esteroisómero, enantiómero, precursor hidrolizable *in vivo* o sal farmacéuticamente aceptable de cualquiera de los compuestos anteriores.

10. Un compuesto seleccionado del grupo que consiste de

N,N-dimetil-1-{5-[(2R)-3'H-espiro[4-azabicyclo[2.2.2]octano-2,2'-furo[2,3-b]piridin]-5'-il]-2-furil}metenamina;

- 20 N,N-dimetil-1-{4-[(2R)-3'H-espiro[4-azabicyclo[2.2.2]octano-2,2'-furo[2,3-b]piridin]-5'-il]-2-furil}metenamina;

N-metil-1-{5-[(2R)-3'H-espiro[4-azabicyclo[2.2.2]octano-2,2'-furo[2,3-b]piridin]-5'-il]-2-furil}metenamina ;

- 25 (2R)-5'-[5-(pirrolidin-1-ilmetil)-2-furil]-3'H-espiro[4-azabicyclo[2.2.2]octano-2,2'-furo[2,3-b]piridina] ;

(2R)-5'-[5-(morfolin-4-ilmetil)-2-furil]-3'H-espiro[4-azabicyclo[2.2.2]octano-2,2'-furo[2,3-b]piridina];

N,N-dimetil-1-{4-[(2R)-3'H-espiro[4-azabicyclo[2.2.2]octano-2,2'-furo[2,3-b]piridin]-5'-il]-2-furil}metenamina;

- 5 (2R)-5'-[5-(pirrolidin-1-ilmetil)-3-furil]-3'H-espiro[4-azabicyclo[2.2.2]octano-2,2'-furo[2,3-b]piridina];

(2R)-5'-[5-(morfolin-4-ilmetil)-3-furil]-3'H-espiro[4-azabicyclo[2.2.2]octano-2,2'-furo[2,3-b]piridina];

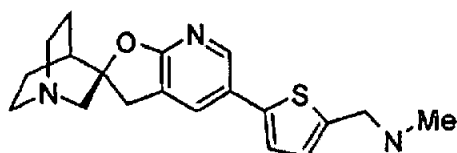
- 10 N-metil-N-({5-[(2R)-3'H-espiro[4-azabicyclo[2.2.2]octano-2,2'-furo[2,3-b]piridin]-5'-il]-2-furil}metil)ciclopropanamina;

N-metil-N-({4-[(2R)-3'H-espiro[4-azabicyclo[2.2.2]octano-2,2'-furo[2,3-b]piridin]-5'-il]-2-furil}metil)ciclopropanamina;

1-{5-[(2R)-3'H-espiro[4-azabicyclo[2.2.2]octano-2,2'-furo[2,3-b]piridin]-5'-il]-2-furil}metenamina;

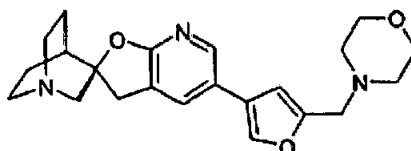
- 15 o un esteroisómero, enantiómero, precursor hidrolizable *in vivo* o sal farmacéuticamente aceptable de cualquiera de los compuestos anteriores.

11. Un compuesto de fórmula



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

- 20 12. Un compuesto de fórmula



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

13. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo de acuerdo con la Reivindicación 1 y al menos un diluyente, lubricante o portador farmacéuticamente aceptable.
14. El uso de un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, un enantiómero
5 del mismo o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en la fabricación de un medicamento para el tratamiento o profilaxis de enfermedades o condiciones humanas en las cuales es benéfica la activación del receptor nicotínico alfa-7, seleccionadas de desórdenes neurológicos, desórdenes psicóticos, desórdenes de deterioro intelectual, enfermedad de Alzheimer, déficit de aprendizaje, déficit
10 cognitivo, déficit de atención, pérdida de la memoria, trastorno de Hiperactividad y Déficit de Atención, ansiedad, esquizofrenia, manía o depresión maniaca, enfermedad de Parkinson, enfermedad de Huntington, síndrome de Tourette o desórdenes neurodegenerativos en los cuales existe pérdida de las sinapsis colinérgicas.
15. El uso de un compuesto o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo de acuerdo con la reivindicación 1, en la fabricación de un medicamento para el tratamiento o profilaxis de desfase horario, dolor o colitis ulcerativa o para facilitar el dejar de fumar o el tratamiento de la adicción a la nicotina o las ansias incluyendo la que resulta de la exposición a productos que contienen nicotina.