

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 6-108716-A -9	FECHA: 2013-01-29 15:39:10
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 7
ACT: 519 PRESENTACION	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
CASTELLANOS ABONDANO MARGARITA
info@castellanosyco.co

Asunto: Radicación: 6-108716-A -9
 Trámite: 11
 Evento: 378
 Actuación: 519
 Oficio: 1516
 Folios: 7

Patente de Invención	X			Patente de Modelo de Utilidad	
Vía Nacional					
Vía PCT (Fase Nacional)	X	Capítulo I	X	Capítulo II	
No. Solicitud Internacional	PCTUS2005/010120				
Fecha de Presentación Internacional	25/03/2005				

1. Documentos estudiados

Descripción:	Folios 21 a 228	25/Octubre/2006
	Folios 322 a 324	24/Mayo/2011
Reivindicaciones:	Folios 230 a 246	25/Octubre/2006
	Folios 309 a 321	24/Mayo/2011
Prioridad:	US 60 555 951	25/Marzo/2004
	US 60 616033	25/Marzo/2004

2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de prioridad porque ésta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

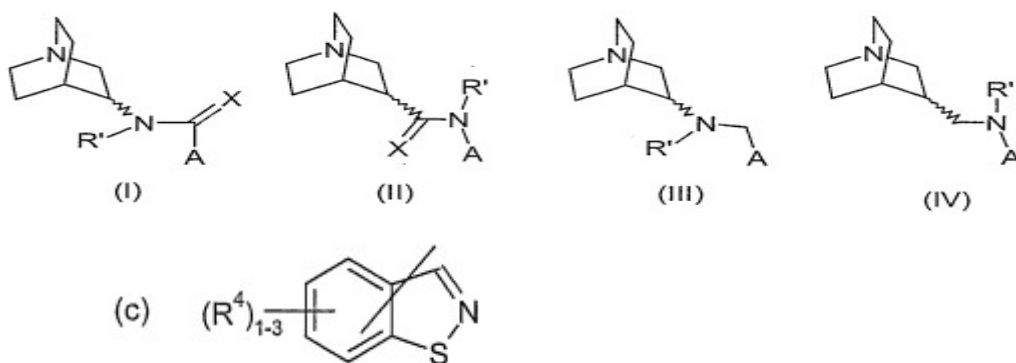
3. Objeto de la invención

De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del Capítulo Primero del Título X de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por el solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es que cuando la solicitud contenga más de diez (10) reivindicaciones y no se haya pagado la tasa complementaria, sólo se estudiarán las cubiertas por la tasa pagada.

Título de la solicitud: "INDAZOLES, BENZOTIAZOLES, BENZOISOTIAZOLES, BENZISOXAZOLES Y PREPARACIÓN Y USOS DE ESTOS".

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar compuestos que actúen como ligandos del receptor del subtipo $\alpha 7nACh$ en el tratamiento de enfermedades asociadas con receptores nicotínicos de acetilcolina defectuosos o con un funcionamiento incorrecto.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de las fórmulas:



Donde A es: , y las composiciones que los contienen.

El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 453/02, A61K 31/439, A61K 31/4745, A61K 31/439.

4. De la solicitud de patente

Titulo

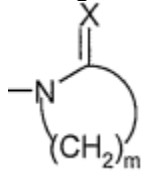
El título no corresponde con el objeto de la solicitud porque es muy general, se sugiere ajustarlo a la materia que se reclama teniendo en cuenta que la reivindicación 1 esta limitada a la opción c) como único significado de A: Benzoisotiazoles, además no debe aparecer la expresión "y usos de estos".

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

Las reivindicaciones 1 y sus dependientes no son claras porque aparece que se elige como significado de A, la estructura de la opción b) la cual no es concordante con la descripción ya que en la descripción dicha estructura corresponde a la opción c), de manera que el significado de R3 no debe aparecer en la reivindicación 1, ya que no hace parte de ella.

En la descripción no existe sustento para las fórmulas (II), (III) y (IV).

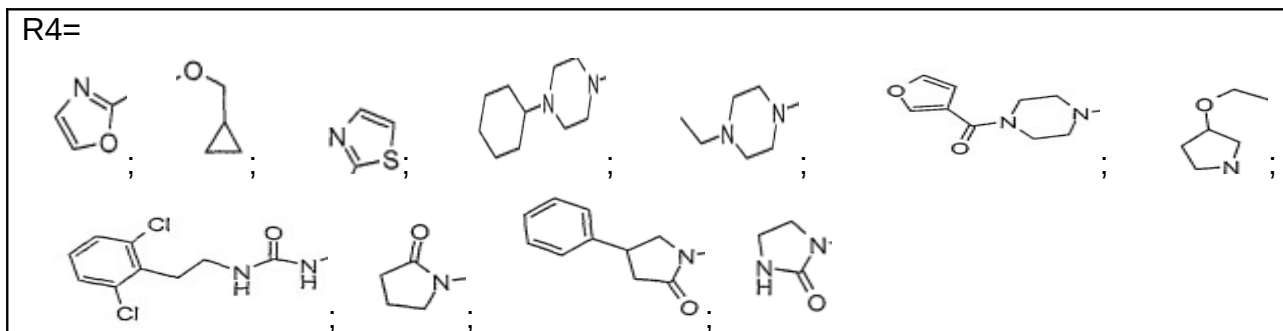
En los significados de R4 aparecen varios que contienen el radical R2 pero no aparece el significado de R2; también existe un significado que corresponde a la fórmula



pero no aparece el valor de m (se tomo el valor de la descripción pág. 4).

Se debe realizar las correcciones pertinentes, dado que las reivindicaciones deben ser claras por sí mismas.

Las Reivindicaciones 1 y sus dependientes no son concisas porque presentan términos como “aril”, “het”, se sugiere definir dichos términos y hacer una razonable generalización del tipo de compuestos que ha sido sintetizado ó probado, con la actividad biológica que se les atribuye, como ligandos del receptor del subtipo $\alpha 7nACh$ (anexo 1, Fls. 352 a52 a54); teniendo en cuenta que los compuestos soportados presentan las siguientes sustituciones en R4.



Se requiere al Solicitante hacer las aclaraciones y/o correcciones necesarias.

Descripción (Art 28 D 486)

En la descripción el nombre de los compuestos 219, 293 no corresponden con la estructura (Pág. 177, Fl.195; Pág. 200, Fl.218).

Se requiere al solicitante hacer las aclaraciones y/o correcciones necesarias.

5. Determinación del Estado de la Técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de prioridad: marzo 25 de 2004 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

N°	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D2	US2003073707	“Quinuclidine-substituted heterobicyclic aromatic compounds for the treatment of disease”	Abril 17 de 2003
D4	JP2002-030084	“1-azabicycloalkane compound and pharmaceutical use thereof”	Enero 29 de 2002

D2¹ divulga diferentes compuestos con actividad como ligandos del receptor del subtipo $\alpha 7nACh$ con sustituyentes tales como el indazol, 1,3 benzoxazol, 1,3-benzodioxol, 2-benzotiofeno, 1,3-benzotiazol, 1,2-benzisotiazol; los cuales se unen al grupo carboxamida tanto por el anillo de seis miembros (benceno) como por el de 5 miembros. (ejemplos págs. 18 a 27, pág.2 párrafos 24 y 26 y pág. 10, parr.131).

D4² en su descripción enseña diferentes compuestos derivados de quinuclidina caracterizados porque tienen actividad como agonistas o agonistas parciales del receptor α nicotínico, presentan sustituyentes Ar como benzotiazol, 1,2 benzisoxazol, 1,2-benzisotiazol, 1-benzotiofeno, quinolina isoquinolina y además menciona que dichos sustituyentes pueden estar unidos a Y:(C=O) a través de cualquiera de los átomos de carbono (Fls. 325-333).

6. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

¹[http://worldwide.espacenet.com/searchResults?](http://worldwide.espacenet.com/searchResults?compact=false&PN=US2003073707&ST=advanced&locale=en_EP&DB=EPODOC)

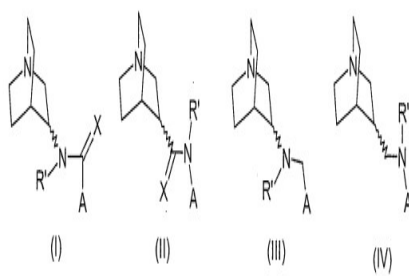
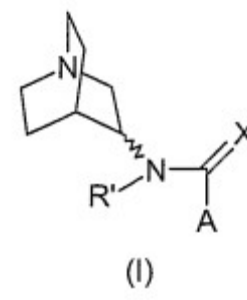
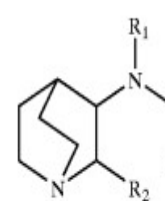
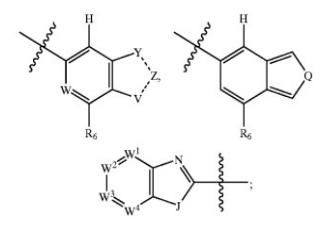
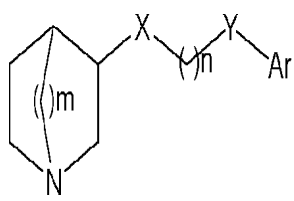
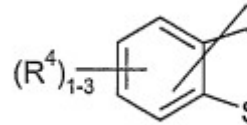
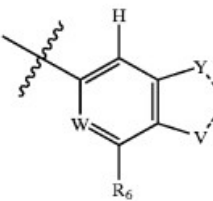
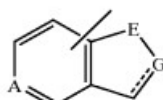
[compact=false&PN=US2003073707&ST=advanced&locale=en_EP&DB=EPODOC](http://worldwide.espacenet.com/searchResults?compact=false&PN=US2003073707&ST=advanced&locale=en_EP&DB=EPODOC)

² <http://www4.ipdl.inpit.go.jp/Tokujitu/tjsogodbenk.ipdl>.

Nivel inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en un compuesto de azabicyclo-octano carcaterizado porque tiene la fórmulas (I), (II),(III),(IV) (FI.309 a 313).

Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D2	D4
compuesto de azabicyclo-octano carcaterizado porque tiene la fórmulas (I), (II),(III),(IV)  (I) (II) (III) (IV)  (I)	compuesto de azabicyclo-octano representado por la fórmula (I)  fórmula (I) donde W° es un biciclo de fórmulas 	compuesto de azabicyclo-octano representado por la fórmula (I)  (I) donde m=2(quinuclidina); X=NH;n=0; Y=C(O) se forma NH-C(O)
donde A es=  (R⁴)₁₋₃ y se encuentra unida al resto del compuesto por su posición 3.	 V-Z-Y= S-N=C(R5) y R5=H  (parr.13 y 21). E-G= N y S; A=C(R18) y R18=H (parr.25,26 y 35) Ejemplos: compuestos que incluyen 1,2-benzoisotiazol-5-carboxamida o 1,2-benzoisotiazol-6-carboxamida (Pág.10 parr.131). R6= sustituyentes del heterociclo aromático biciclo se tienen= Halógenos, N(R16) dfimetilamino.	Ar es 1,2-benzisotiazol, indol, benzotiazol, quinolona, isoquinolona. Como sustituyentes del heterociclo aromático biciclo se tienen: Halógenos, dimetilamino,dietilamino, piperidina, pirrolizina, formilo, ácidos carboxílicos ...etc (FI. 3245-333).

Los documentos D2 y D4 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque D2 divulga diferentes compuestos con actividad como ligandos del receptor del subtipo $\alpha 7nACh$ con sustituyentes tales como el indazol, 1,3 benzoxazol, 1,3-benzodioxol,2-benzotiofeno,1,3-benzotiazol, los cuales se unen al grupo carboxamida tanto por el anillo de seis miembros (benceno) como por el de 5 miembros (ver ejemplos págs. 18 a 27, pág.2 párrafos 24 y 26), también divulga las composiciones farmacéuticas que los contienen (pag.6, párr.99; pág.12, parr.177, 178) y adicionalmente enseña un grupo de compuestos que comprenden el biciclo 1,2-benzisotiazol (1,2-benzoisotiazol-5-carboxamida ó 1,2-benzoisotiazol-6-carboxamida, pág. 10, parr.131 y 132).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto de D2 consiste en la ubicación del biciclo 1,2-benzoisotiazol, el cual en los compuestos reclamados está en la posición 3.

El efecto que logra el incluir es que algunos de los compuestos reivindicados tienen una mayor actividad farmacológica como ligandos del receptor del subtipo $\alpha 7nACh$ frente a los compuestos conocidos.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo modificar el compuesto conocido en D2 para conseguir una mayor actividad farmacológica como ligandos del receptor del subtipo $\alpha 7nACh$ ”.

En el anexo 1 (Fls. 352 a 354) se adjuntan datos de actividad de los compuestos en donde se presentan tres grupos, los cuales están clasificados de acuerdo a los rangos de actividad expresado en EC50 así, grupo 1 igual a 1nM a menor que 10 nM; grupo 2 igual a 10nM a menor que 100 nM; grupo 3 igual a 100nM a menor que 1000 nM. Por lo tanto tal como lo muestran los resultados (rango de actividad desde 1 nM hasta menor a 1000 nM) no se puede evidenciar un efecto sorprendente en la generalidad y totalidad de los compuestos tal como se reclaman en la reivindicación 1.

Sin embargo, en D4 se divulga que los sustituyentes biciclo (Ar) puede ser, entre otros, el 1,2-benzoisotiazol y que dicho sustituyente puede estar unido a Y:(C=O) a través de cualquiera de los átomos de carbono (Fls. 325-333). De manera que comparando los resultados allegados en el anexo 1 con los datos de la tabla de D4 (Fl.329), se puede concluir que sólo los compuestos del grupo 1 presentan un efecto superior a los compuestos conocidos.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría el biciclo 1,2-benzoisotiazol del documento D2 y D4, en la posición 3 por lo divulgado en este último documento para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2-30 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

7. Conclusión

Los requisitos de Patentabilidad de la presente solicitud están afectados así:

N°	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D2	US2003073707	1-30	Nivel Inventivo
D4	JP2002-030084	1-30	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 (60) 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.

Se invita al solicitante se sirva indicar, si así lo considera, su renuncia al término faltante de sesenta (60) días para dar respuesta a este requerimiento y presentarla por escrito.

Finalmente, se le recuerda al solicitante que si como respuesta a este requerimiento llegara a modificar el capítulo reivindicatorio y éste contenga más de diez (10) reivindicaciones, no pagará la tasa de modificación voluntaria pero sí la correspondiente al pago por reivindicación adicional.

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 No. 10 de 2001.



JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ
Director de Nuevas Creaciones (c)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 2013-02-05

Elaboró: Lyna Del Carmen Mordecay Dunoyer
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Rozo