

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 12374

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/06-108716 A

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO
en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las que se confirieron en el artículo 3,
numeral 26, del Decreto 4886 de 2011, y

CONSIDERANDO:

PRIMERO: Que mediante escrito radicado ante esta Superintendencia el 25 de octubre de 2006 con el N° 06-108716-00000-0000, por la sociedad MEMORY PHARMACEUTICALS CORPORATION, a través de apoderado, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "INDAZOLES, BENZOTIAZOLES, BENZOISOTIAZOLES, BENZISOXAZOLES Y PREPARACIÓN Y USOS DE ESTOS", que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2005/010120 del 25 de marzo de 2005.

SEGUNDO: Que mediante escrito del 15 de octubre de 2010, radicado por la doctora Margarita Castellanos Abondano, la solicitante allegó la presente solicitud divisional No. 06 – 108716 A, la cual se derivó de la mencionada solicitud inicial 06-108716 y, por ende, se beneficia de la fecha de su presentación. El título de la solicitud divisional es: "INDAZOLES, BENZOTIAZOLES, BENZOISOTIAZOLES, BENZISOXAZOLES Y PREPARACIÓN Y USOS DE ESTOS".

TERCERO: Que realizado el examen de patentabilidad con fundamento en lo dispuesto en el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se requirió a la solicitante mediante Oficio N° 663, notificado el 14 de enero de 2011, para que se pronunciara sobre las objeciones efectuadas a la solicitud, en cuanto a la carencia de novedad, conforme lo establece el artículo 16 de la Decisión 486 anteriormente mencionada.

CUARTO: Que la solicitante mediante escrito radicado bajo el N° 06-108716-A-00003-0000 del 24 de mayo de 2011, respondió oportunamente el requerimiento formulado, y presentó nuevas reivindicaciones 1 a 30 (Fls. 309 a 321) que reemplazan las originalmente presentadas, atendiendo de esta manera las observaciones efectuadas en el examen de fondo. Se aceptó el nuevo capítulo reivindicatorio presentado, comoquiera que se ajusta a las prescripciones contenidas en el artículo 34 de la Decisión 486.

QUINTO: Que según lo dispuesto en el artículo 14 de la Decisión 486 expedida por la Comisión de la Comunidad Andina se otorgarán patentes "(...) para las invenciones, sean de producto o de procedimiento, en todos los campos de la tecnología, siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial".

SEXTO: Que las reivindicaciones 1 a 30 contenidas en los folios 309 a 321, no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

6.1. Objeto de la invención.

El objeto de la invención consiste en la necesidad de suministrar compuestos que actúen como ligandos del receptor del subtipo $\alpha 7nACh$ para el tratamiento de enfermedades

Página 1 de 6

Al contestar favor indique el número
de radicación que se indica a continuación:
Cod Verificación: 1477996137

S Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 pisos 2, 5, 7 y 10 PBX: 5870000
Sede CAN: Av. Carrera 50 No. 26- 55 int. 2 Tel. 5737020
Call Center 5920400. Línea gratuita Nacional 01800-910165
Web: www.sic.gov.co e-mail: contactenos@sic.gov.co
Bogotá D.C. Colombia

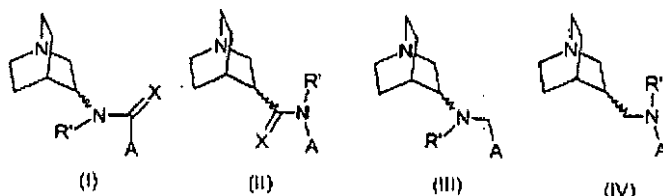
REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 12374

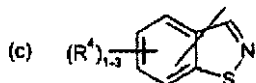
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/06-108716 A

asociadas con receptores nicotínicos de acetilcolina defectuosos o con un funcionamiento incorrecto. Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona compuestos de las fórmulas:



donde A es:



6.2 Determinación del estado de la técnica.

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 25 de marzo de 2004, que corresponde a la fecha de la prioridad invocada.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos anteriores a la fecha de reivindicación de prioridad, relacionados con la materia de la solicitud en estudio:

Ítem	Documento	Título	Fecha de publicación
D2	US2003073707	"Quinuclidine-substituted heterobicyclic aromatic compounds for the treatment of disease"	17/04/2003
D4	JP2002-030084	"1-azabicycloalkane compound and pharmaceutical use thereof"	29/01/2002

El documento D2¹ revela diferentes compuestos ligandos de receptores nicotínicos $\alpha 7nACh$ derivados de 3-sustituido-1-azabicyclo[2.2.2]octano con sustituyentes indazol, 1,3-benzoxazol, 1,3-benzodioxol, 2-benzotiofeno, 1,3-benzotiazol, 1,2-benzisoxazol, los cuales se unen al grupo carboxamida tanto por el anillo de seis miembros (benceno) como por el anillo de 5 miembros (ver ejemplos páginas 18-27 y página 2 párrafos [0024]-[0026]).

¹<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?>

[DB=worldwide.espacenet.com&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20030417&CC=US&NR=2003073707A1&KC=A1](http://worldwide.espacenet.com&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20030417&CC=US&NR=2003073707A1&KC=A1)

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 12374

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/06-108716 A

El documento D4² divulga en su descripción compuestos derivados de quinuclidina caracterizados por ser agonistas o agonistas parciales del receptor α -nicotínico, entre los sustituyentes Ar establecidos se encuentran benzotiazol, 1,2-benzisoxazol, 1,2-benzotiazol, 1-benzotiofeno, quinolina e isoquinolina, adicionalmente menciona que dichos compuestos aromáticos heterocíclicos pueden estar unidos a Y:(C=O) por cualquiera de los átomos de carbono (ver folios 325-333).

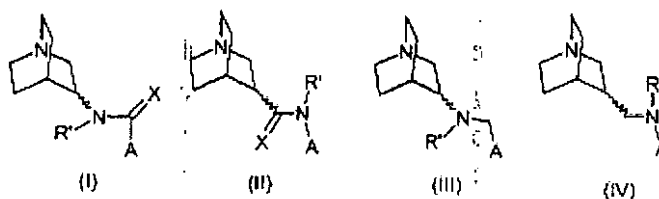
6.3. Nivel inventivo.

Según lo dispuesto en el artículo 18 de la Decisión 486:

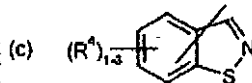
"Se considerará que una invención tiene nivel inventivo, si para una persona del oficio normalmente versada en la materia técnica correspondiente, esa invención no hubiese resultado obvia ni se hubiese derivado de manera evidente del estado de la técnica".

"El estado de la técnica comprenderá todo lo que haya sido accesible al público por una descripción escrita u oral, utilización, comercialización o cualquier otro medio antes de la fecha de presentación de la solicitud de patente o, en su caso, de la prioridad reconocida".

En el presente caso, los compuestos reclamados en la solicitud no poseen nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 está referida a: un compuesto aza-biciclo octano caracterizado porque tiene las fórmulas I, II, III y IV:



donde A es:



(FI.309).

La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la reivindicación 1, y las reveladas en los

<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?>

worldwide.espacenet.com&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=200

[20129&CC=JP&NR=2002030084A&KC=A](http://worldwide.espacenet.com&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=200)

Página 3 de 6

Al contestar favor indique el número de radicación que se indica a continuación:
Cod Verificación: 1477996137

S Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 pisos 2, 5, 7 y 10 PBX: 5870000
Sede CAN: Av. Carrera 50 No. 26- 55 int. 2 Tel 5737020
Call Center 5920400. Línea gratuita Nacional 01800-910165
Web: www.sic.gov.co e-mail: contactenos@sic.gov.co
Bogotá D.C. Colombia

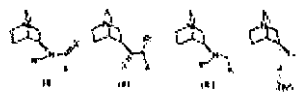
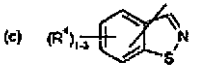
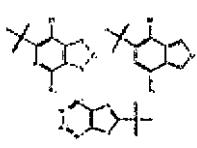
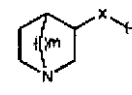
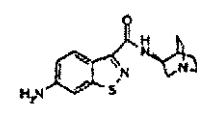
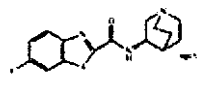
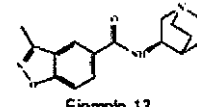
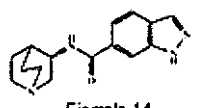
REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 12374

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/06-108716 A

documentos D2 y D4 que representan el estado de la técnica:

Características esenciales:	D2	D4
 donde A es: 	 Donde W ⁶ es un bídico:  W es -CH y V-Y-Z es S- N=CH (páginas 2-4)	 (folio 325)
 Ejemplo 197	 Ejemplo 1002  Ejemplo 13  Ejemplo 14	En donde: m es 2 (quinuclidina) X es NH, n es 0, Y es C(O). (se forma el grupo NH-C(O) ó m es 2 (quinuclidina) X es NH, n es 0 y Y es CH ₂ Se forma el grupo NH-CH ₂ Y Ar es 1,2-benzisotiazol, indol, benzotiazol, benzofurano, benzotiofeno, quinolina, is quinolina. Como sustituyentes del heterociclo aromático bídico se establecen: Halógenos, dimetilamino, dietilamino, piperidina, pirrolizina, ácidos carboxílicos, formilo...etc. (ver folios 325- 333)

El documento D2 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga diferentes compuestos ligandos de receptores nicotínicos $\alpha 7nACh$ derivados de 3-sustituido-1-azabíciclo[2.2.2]octano con sustituyentes indazol, 1,3-benzoxazol, 1,3-benzodioxol, 2-benzotiofeno, 1,3-benzotiazol, 1,2-benzisoxazol, los cuales se unen al grupo carboxamida tanto por el anillo de seis miembros (benceno) como por el anillo de 5 miembros (ver ejemplos páginas 18-27 y página 2 párrafos [0024]-[0026]).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1, y los compuestos revelados en D2, consiste específicamente en el grupo heteroarilo bídico (1,2-benzisotiazol) con diferentes sustituyentes sobre dicho heteroarilo bídico.

Esta diferencia no parece conceder un efecto técnico inesperado o una ventaja a los compuestos reclamados en la presente solicitud, ya que no presentan una mayor actividad

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 12374

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/06-108716 A

agonista de los receptores nicotínicos alfa-7 de acetilcolina ($\alpha 7nACh$) en comparación con los compuestos del estado de la técnica más cercano.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo modificar los compuestos revelados en D2 para obtener compuestos alternativos que actúen como agonistas de los receptores nicotínicos alfa-7 de acetil colina ($\alpha 7nACh$).

Sin embargo, el documento D4 ya divulgaba compuestos derivados de quinuclidina los cuales son agonistas o agonistas parciales del receptor alfa-7 nicotínico. Los compuestos de quinuclidina (cuando m es 2), donde un grupo carboxamida (cuando X es NH, n es 0, Y es C(O), o un grupo aminometilo (cuando X es NH, n es 0 y Y es CH₂) (ver folio 325 párrafo [0010], pueden estar sustituidos por anillos heteroarilos bicíclicos como benzotiazol, 1,2-benzisotiazol, indol, benzofurano, benzotiofeno, quinolina, isoquinolina, entre otros (ver folio 326 párrafo [0013]). Adicionalmente dicho anillo heteroarilo bicíclico, puede unirse por cualquier átomo de carbono con Y (CO) o CH₂ (Ver párrafo [0013], última línea) y puede tener diferentes sustituyentes (ver párrafo [0014]).

Una persona de nivel medio versada en la materia conociendo lo revelado en D2, el cual revela que al sustituir el grupo farmacofórico carbamoil-quinuclidina con diferentes grupos aromáticos bicíclicos como indazol, 1,3-benzoxazol, 1,3-benzodioxol, 2-benzotiofeno, 1,3-benzotiazol, 1,2-benzisoxazol los cuales se pueden unir al grupo farmacofórico tanto por el anillo de benceno como por el anillo heterocíclico, se vería motivado a sintetizar los compuestos revelados en la presente solicitud, teniendo en cuenta lo revelado en D4 el cual enseña que dicho farmacóforo puede estar sustituido también por un grupo 1,2-benzisotiazol el cual puede estar unido por cualquiera de los átomos de carbono y adicionalmente puede tener diferentes sustituyentes (ver párrafo [0014]).

Por tanto, teniendo en cuenta que no se encuentra ninguna ventaja o efecto sorprendente de los compuestos reivindicados respecto a los compuestos revelados en el estado de la técnica, se considera que la invención carece de nivel inventivo.

Por su parte, las reivindicaciones dependientes 2 a 30 no mencionan alguna característica que le confieran nivel inventivo a los compuestos de la reivindicación 1, por lo tanto, tampoco cumplen con lo establecido en el mencionado artículo 18 de la Decisión 486.

En conclusión, teniendo en cuenta que los argumentos de la solicitante no desvirtúan de manera alguna las objeciones a la patentabilidad ya sustentada, el Superintendente de Industria y Comercio,

RESUELVE:

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 12374

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/06-108716 A

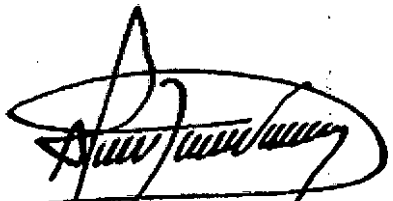
ARTÍCULO PRIMERO: Denegar la patente de invención a la creación titulada "INDAZOLES, BENZOTIAZOLES, BENZOISOTIAZOLES, BENZISOXAZOLES Y PREPARACIÓN Y USOS DE ESTOS".

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar personalmente el contenido de la presente resolución a la doctora Margarita Castellanos Abondano, en su calidad de apoderada de MEMORY PHARMACEUTICALS CORPORATION, o a quien haga sus veces, entregándole copia de la misma y advirtiéndole que contra ella procede el recurso de reposición, ante el Superintendente de Industria y Comercio, el cual podrá ser interpuesto en el momento de la notificación o dentro de los 5 días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE

Dada en Bogotá D.C., a los 29 Feb 2012

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO (E),


ADOLFO LEÓN VARELA SÁNCHEZ

Doctora

MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO

Calle 94 A N° 7 A - 09.

Elaboró: Juanita Catalina Rico Valbuena ✓

Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Roza ✓

Revisó: Jesus Fernel Garcia Garcia ✓

Revisó: Jose Luis Salazar Lopez ✓

Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez ✓