

197
2 197

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 02-101292- -00005-0000

Fecha: 2008-02-12 16:51:14 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra. 11 PATENTE IYI Eve: 379 FASENACIONAL
Act. 444 RESPUESTA REQUE Folios: 15

Re: Expediente No. 02-101292

Solicitud de patente titulada: "DERIVADOS DE 3-(3-ISOPROPIL-5-METIL-4H-1,2,4-TRIAZOL-4-IL)-EXO-8-AZABICICLO [3.2.1] OCTANO, PROCESOS PARA SU PREPARACIÓN, INTERMEDIARIOS EMPLEADOS EN SU PREPARACIÓN Y COMPOSICIONES QUE LOS CONTIENEN"

Solicitante: PFIZER INC.

RESPUESTA AL OFICIO No 14691 NOTIFICADO POR FIJACION EN LISTA No. 420
DE FECHA 16 DE NOVIEMBRE DE 2007.
(EXAMEN DE FONDO)

CARLOS R. OLARTE, mayor de edad y vecino de Bogotá, identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi carácter de apoderado de la sociedad solicitante, me permito manifestar lo siguiente ante el auto emanado por ese Despacho, dentro del plazo legal previsto en el artículo 45 de la Decisión 486:

1. En primer lugar y con el ánimo de brindar mayor claridad a la presente solicitud, me permito adjuntar un **Capítulo Reivindicatorio Modificado** compuesto por 29 reivindicaciones, que reemplaza en su totalidad al Capítulo Reivindicatorio Modificado de 27 reivindicaciones, presentado mediante mi memorial del 29 de Noviembre de 2004.

Las modificaciones efectuadas a la solicitud se resumen a continuación:

- Se eliminaron las antiguas Reivindicaciones 15 a 22;

198
198

- La Reivindicación 8 que hacía referencia a un grupo de 5 compuestos, fue dividida en 5 reivindicaciones cada una reclamando un compuesto por separado;
- Se incluye la nueva Reivindicación 19 que define el proceso para la obtención del compuesto de la invención;
- Las nuevas Reivindicaciones 20 a 23 son dependientes de la Reivindicación 19 y reclaman los compuestos empleados en el proceso de síntesis;
- Adicionalmente, se incluyen las nuevas reivindicaciones 24 a 29 dirigidas a combinaciones del compuesto de fórmula I con uno o más agentes terapéuticos, las cuales encuentran sustento en el Capítulo Descriptivo de la página 38, línea 20, a la página 40, línea 19.

Valga anotar que las modificaciones efectuadas cumplen a cabalidad con lo estipulado en el Artículo 34 de la Decisión 486, ya que éstas de ninguna manera implican una ampliación de la protección correspondiente a la divulgación contenida en la solicitud inicial. Por el contrario, los cambios realizados son una franca limitación del alcance pretendido inicialmente.

2. a- El Examinador sugiere que el título de la solicitud sea modificado de tal forma que se incluya la naturaleza química de los compuestos reivindicados.

b- Atendiendo la recomendación del Examinador, me permito modificar el título como sigue:

“DERIVADOS DE 3-(3-ISOPROPIL-5-METIL-4H-1,2,4-TRIAZOL-4-IL)-EXO-8-AZABICICLO [3.2.1] OCTANO, PROCESOS PARA SU PREPARACIÓN, INTERMEDIARIOS EMPLEADOS EN SU PREPARACIÓN Y COMPOSICIONES QUE LOS CONTIENEN”.

3. a- El Examinador considera adicionalmente que las reivindicaciones comprenden términos amplios tal como “opcionalmente”, “uno o más”, “en el anillo”, “uno a tres”, “alguno”, “grupo protector”, “preferiblemente”, “grupo activación”, “reducción”, “acoplamiento”, “sal metálica” y “compuesto quiral”

b- i) En respuesta a lo anterior, debo resaltar que el Manual Andino de Patentes establece que la Descripción debe estar escrita en el lenguaje propio de la materia técnica, y que

las reivindicaciones deben interpretarse de acuerdo con la descripción.¹ La Descripción de la presente invención incluye suficientes detalles que permiten determinar completamente el alcance de la materia reivindicada. Es más, la descripción proporciona la definición de los términos genéricos empleados en la solicitud, ejemplificando muchos de los significados preferidos para cada uno de esos términos con el objeto de ilustrar completamente su alcance (v.gr., compuestos preferidos página 6, esquemas de síntesis 1-6, páginas 7 a 27; ejemplos 1-7, páginas 47 a 57; preparaciones 1-25, páginas 57 a 85)

Adicionalmente, me permito señalar que los términos listados por el Examinador corresponden al lenguaje estándar del campo químico y por lo tanto son comprensibles y absolutamente claros para cualquier técnico medianamente versado en la materia.

ii) De otra parte, llamo respetuosamente la atención del Examinador al hecho que el Manual Andino de Patentes establece que los términos opcionales son perfectamente aceptables en las reivindicaciones y deben entenderse como no limitativos, en particular para la evaluación de la novedad y el nivel inventivo.² Así entonces, insisto respetuosamente en términos como “opcionalmente”, “uno o más”, “uno a tres”, “alguno”, preferiblemente”, que el Examinador equivocadamente objeta. De hecho, es importante resaltar que la SIC históricamente ha concedido patentes de invención para invenciones que incluyen dichos términos en sus reivindicaciones, lo que está en perfecta concordancia con la práctica internacional de patentes que acepta igualmente el uso de tales expresiones.

4. a- El Examinador establece que la materia reclamada en las Reivindicaciones 1 a 7 es amplia e inconcisa y no limita el alcance de la invención.

b- Respetuosamente debo aclarar que el solicitante tiene el derecho de reclamar protección para la totalidad del concepto inventivo desarrollado, y éste no puede ser limitado basado en apreciaciones subjetivas del Examinador. Aún cuando las formulas Markush proveen múltiples sustituyentes y permiten la reclamación de diferentes compuestos, estructuralmente diferentes, todos estos compuestos están comprendidos dentro de un único concepto inventivo correspondiente al núcleo estructural común de 3-(3-isopropil-5-metil-4H-1,2,4-triazol-4-il)-exo-8-azabicyclo [3.2.1]octano, que por lo demás, presentan igualmente un efecto técnico similar. Así mismo, es importante aclarar que las permutaciones comprendidas en una formula Markush, son limitadas y permiten que una persona versada en la técnica pueda identificar fácilmente el

¹ Manual Andino de Patentes, OMPI 2004. ISBN 9978-43-855-6. Sección 3.2, 4.6.1 y 4.6.2

² Manual Andino de Patentes, OMPI 2004. ISBN 9978-43-855-6. Sección 4.6.5

200
200
A

alcance de la invención. En este sentido, llamo respetuosamente la atención del Examinador al hecho que las Cámaras de Apelaciones de la EPO han determinado que en relación con reivindicaciones que contienen fórmulas Markush, éstas son claras si es posible establecer con absoluta certeza, y dentro de una cantidad de tiempo razonable, si un compuesto dado cae dentro de su alcance o no.³ Adicionalmente, el requerimiento de claridad en patentes no brinda fundamento alguno para objetar reivindicaciones basándose en la complejidad de éstas o la dificultad para entenderlas, dado que la complejidad no es equivalente a falta de claridad en una reivindicación. Este tipo de objeciones contra la claridad resultan abiertamente inapropiadas, ya que excluyen de protección *a-priori* a cualquier invención que comprenda materia para la que no es posible redactar su descripción mediante la formulación de reivindicaciones simples.⁴

Ahora bien, considerando que las moléculas reclamadas se encuentran correctamente caracterizadas mediante la definición de un núcleo estructural común que atribuye la actividad biológica; y que todas las sustituciones propuestas están basadas en el derecho del inventor a reclamar protección para cualquier modalidad del concepto inventivo que desarrolló, resulta evidente que la definición de la presente invención mediante las fórmulas Markush utilizada es la forma más concisa de formular la materia comprendida en la totalidad del concepto inventivo de la presente solicitud.

5. a- El Examinador establece que el proceso reclamado en la Reivindicación 27 no especifica los pasos ni las condiciones de reacción que involucra (acoplamiento, reducción y alquilación), como tampoco los reactivos que emplea (activador, grupos ausentes, sal metálica, definición de R⁵). Adicionalmente el Examinador anota que el procedimiento esta caracterizado por los productos, lo que no limita el proceso en sí mismo.

b- El proceso reclamado en la nueva Reivindicación 19 define la secuencia completa de etapas necesarias para preparar los compuestos de la invención. Así, una persona versada en la materia puede identificar claramente el alcance de dicho proceso.

Resulta importante aclarar que en las reivindicaciones no es necesario incluir elementos NO ESENCIALES de la invención reclamada, como son, por ejemplo, las condiciones específicas necesarias para llevar a cabo el procedimiento inventivo reivindicado. Por el contrario, y con el fin de presentar claramente las propiedades novedosas e inventivas de la invención, las reivindicaciones deben limitarse a los elementos característicos que lo diferencian del estado de la técnica. Incluir elementos y condiciones específicas NO ESENCIALES en las

³ Me permito citar decisiones de las Cámaras de Apelaciones de la EPO, pues las mismas han servido reiteradamente como fuente interpretativa por el Tribunal Andino de Justicia en sus sentencias.

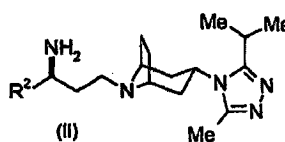
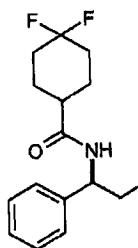
⁴ Decision of Technical Board of Appeal, 27 June 2003 - T 1020/98 - 3.3.1.

201
201
5

reivindicaciones limitaría injustamente el derecho del inventor a reclamar la amplitud del concepto desarrollado.

Vale la pena aclarar el rol del Capítulo Descriptivo, que es el de proveer suficiente información para que una persona versada en la materia pueda eventualmente repetir la invención, y de las Reivindicaciones, que es establecer el alcance de la invención y de la protección otorgada. En éste caso en particular, el Capítulo Descriptivo define las condiciones preferidas para llevar a cabo los procedimientos reivindicados. Adicionalmente en los Ejemplos 1-7 y en las Preparaciones 1-25 se muestra explícitamente cómo sintetizar los compuestos preferidos, incluyendo los procedimientos y condiciones específicas. De esta forma, las condiciones para la síntesis de modalidades adicionales serán evidentes para cualquier persona del campo técnico a la luz del Capítulo Descriptivo y restringir las reivindicaciones a pasos y condiciones específicas, excluiría de protección a las modalidades asociadas con la preparación de compuestos no ejemplificados, pero que hacen parte del concepto inventivo desarrollado.

6. a- El Examinador considera que los compuestos reclamados en las Reivindicaciones 23-26 representan moléculas que no se encuentran relacionados estructuralmente, y que por lo tanto constituyen más de un concepto inventivo. El Examinador hace referencia específica a los siguientes compuestos:



Vale la pena mencionar que las Cámaras de Apelación de la Oficina Europea, citadas frecuentemente por el Tribunal Andino de Justicia (cuyos conceptos han sido aplicados por la SIC en diferentes oportunidades), establecen que los compuestos intermediarios presentan unidad de invención si ellos están inter-conectados estructuralmente con el producto final mediante la incorporación de elementos estructuralmente esenciales dentro de dicho producto.⁵ Teniendo en cuenta que todos los compuestos, finales e intermedios, reclamados en el Capítulo Reivindicatorio Modificado comprenden características estructurales comunes, que permiten una interconexión técnica cercana entre ellos, se encuentra que representan un único objeto de invención, independientemente del número de pasos que puedan estar envueltos en la transformación de los productos intermedios en productos finales.

Sin embargo, con el fin de brindar mayor claridad al Capítulo Reivindicatorio Modificado, las nuevas Reivindicaciones 20 a 23 mencionan en su preámbulo que los compuestos reivindicados corresponden a intermediarios de síntesis del procedimiento reclamado en la Reivindicación 19.

En conclusión, las Reivindicaciones 1 a 12 que reclaman compuestos de Fórmula I; la Reivindicación 20, que reclama un procedimiento para preparar los compuestos de Fórmula I; y las Reivindicaciones 20 a 23, que reclaman compuestos intermediarios del procedimiento para preparar compuestos de Fórmula I; en efecto comparten un concepto inventivo común.

7. a- El Examinador establece que las Reivindicaciones 10 a 22 no son patentables porque caracterizan los compuestos por su uso, o por su uso en métodos de tratamiento.

b- Considero superada la anterior objeción en tanto que las Reivindicaciones 10 a 22 fueron retiradas del Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto.

8. Finalmente, deseo poner bajo su conocimiento que para el concepto inventivo comprendido en la presente solicitud, ha sido otorgado hasta el momento el privilegio de patente por parte de Oficinas de Patentes en Europa (EP1284974), Estados Unidos (US6667314), Australia (AU20011252482) y Canadá (CA2408909). Valga anotar que el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto es equivalente al Capítulo Reivindicatorio concedido por la Oficina Europea de Patentes.

Si bien es cierto que las concesiones de patentes en oficinas de otros países no son vinculantes en el sentido que obliguen a la SIC a tomar una decisión en el mismo sentido, sí considero que

⁵ EPO Boards of Appeal, Número de Caso T0110/82-3.3.1

203
203
X

dichas concesiones sugieren el cumplimiento de los requisitos de patentabilidad de la materia reivindicada, ya que los criterios de evaluación y estudio aplicados para concluir la aceptación de dichas patentes resultan equivalentes a los que la SIC debe emplear. Tan cierto es lo anterior, que el Manual Andino de Patentes, al comentar el Artículo 46 de la Decisión 486, establece que una Oficina nacional competente podrá reconocer los resultados de exámenes de novedad o de patentabilidad efectuados respecto a la solicitud extranjera equivalente, como suficientes para acreditar el cumplimiento de las condiciones de patentabilidad.⁶ En el mismo sentido, es importante anotar que el mismo Tribunal Andino de Justicia ha citado a la jurisprudencia de las Cámaras de Apelación de Oficina Europea de Patentes como antecedentes aplicables a la Decisión 486.⁷

9. Por todo lo anterior, considero que las objeciones presentadas por el Examinador han sido resueltas y por consiguiente solicito respetuosamente que se emita un segundo examen de fondo donde se pronuncie sobre los requisitos de patentabilidad, en particular respecto de la novedad y el nivel inventivo. De lo contrario, ruego se tengan por cumplidos tales requisitos, en tanto no se logró desvirtuar ninguno de ellos por parte de la SIC, y se proceda con la concesión de la patente.

Atentamente,



CARLOS R. OLARTE
C.C. No. 79.782.747 de Bogotá
T.P. 74.295

Anexos: Capítulo Reivindicatorio Modificado.
 Recibo de pago correspondiente a la tasa de modificación.

⁶ Manual Andino de Patentes. Sección 7.3.

⁷ Ver por ejemplo:

- Proceso 193-IP-2005, página 12, donde se cita que “el Tribunal a manera de orientación ha tomado como referencia criterios de las Cámaras de Recursos de la Oficina Europea de Patentes (OEP)” para el análisis de la falta de novedad.
- Proceso No. 216-IP-2003, página 11, donde se menciona a manera de referencia la interpretación y el alcance que dan las directivas de la Oficina Europea de Patentes al término terapia.
- Proceso No. 118-IP-2005, página 15, donde el Tribunal cita a manera de referencia que “a partir de la “decisión adoptada en el caso T-506/95, las Cámaras han establecido que el estado de la técnica más próximo es aquel que...”.
- Proceso 69-IP-2005, página 12, donde el Tribunal explica que “para analizar la existencia de nivel inventivo, las Cámaras de Recursos han adoptado el método llamado de “acercamiento problema-solución” (problem and solution approach)”.
- Proceso No. 101-IP-2005, página 9, donde el Tribunal cita “a título de referencia, el criterio de las Cámaras de Recursos, según el cual los manuales u obras básicas deben formar parte de los conocimientos generales del experto medio”.

~~204~~
204
8

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 11,172
FECHA : FEBRERO 11 DE 2008

No. 02-103323-0000

No. 02-101232--00005-0000

Phone 2006 02-021 1114 Fax 0020 NIDECREAZIONE
Tir 11 PATENTENOM EN 370 FASENACIONALI
A1144 RESPUESTARQUE 100.05 13

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
OLARTE RAISBEK	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	1483388	11/02/2008	5.606.000.00

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LEHAS COMERCIALES	103,000.00
		TOTAL :	\$ 103,000.00

SON: CIENTO TRES MIL PESOS

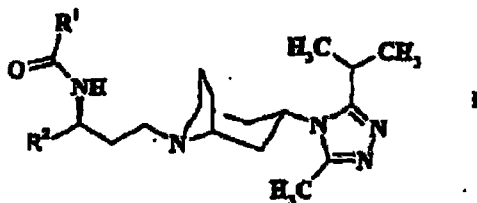
RESPONSABLE :

BO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.

205
205
9.

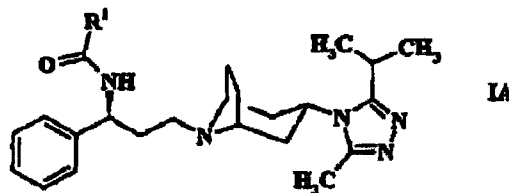
CAPITULO REIVINDICATORIO MODIFICADO

1. Un compuesto de la fórmula:



en donde R^1 es C_{3-6} cicloalquilo opcionalmente sustituido por uno o más átomos de flúor, o C_{1-6} alquilo opcionalmente sustituido por uno o más átomos de flúor, o C_{3-6} cicloalquilmetilo opcionalmente sustituido en anillo por uno o más átomos de flúor; y R^2 es fenilo opcionalmente sustituido por uno o más átomos de flúor: o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo.

2. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 1 de la fórmula:



en donde R^1 representa bien sea C_{3-6} cicloalquilo opcionalmente sustituido por uno o más átomos de flúor o C_{1-6} alquilo opcionalmente sustituido por uno o más átomos de flúor, o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo.

3. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 1 en donde R^1 es tanto C_{4-6} cicloalquilo opcionalmente sustituido por uno o dos átomos de flúor o C_{1-4} alquilo opcionalmente sustituido por uno o hasta tres átomos de flúor.
4. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 3 en donde R^1 es ciclobutilo, ciclopentilo, 4,4- difluorociclohexilo, o 3,3,3- tri- fluoropropilo.
5. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 1, 3 ó 4 en donde R^2 es fenilo opcionalmente sustituido por 1 ó 2 átomos de flúor.
6. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 5 en donde R^2 es fenilo o monofluorofenilo.
7. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 6 en donde R^2 es fenilo o 3- fluorofenilo.

206
206
10

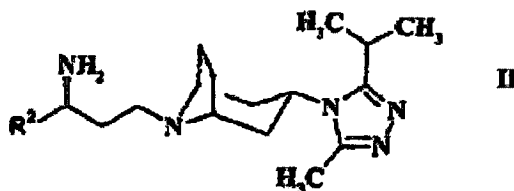
8. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 1 que es: N- {(1S)- 3- [3- (3- isopropil- 5- metil- 4H- 1,2,4- triazol- 4- il)- exo- 8- azabicyclo[3.2.1]oct- 8- il]- 1- fenilpropil}ciclobutanocarboxamida o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo.
9. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 1 que es: N- {(1S)- 3- [3- (3- isopropil- 5- metil- 4H- 1,2,4- triazol- 4- il)- exo- 8- azabicyclo[3.2.1]oct- 8- il]- 1- fenilpropil}ciclopentanocarboxamida o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo.
10. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 1 que es: N- {(1S)- 3- [3- (3- isopropil- 5- metil- 4H- 1,2,4- triazol- 4- il)- exo- 8- azabicyclo[3.2.1]oct- 8- il]- 1- fenilpropil}- 4,4,4- trifluorobutanamida o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo.
11. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 1 que es: N- {(1S)- 3- [3- (3- isopropil- 5- metil- 4H- 1,2,4- triazol- 4- il)- exo- 8- azabicyclo[3.2.1]oct- 8- il]- 1- fenilpropil}- 4,4- difluorociclohexanocarboxamida o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo.
12. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 1 que es: N- {(1S)- 3- [3- (3- isopropil- 5- metil- 4H- 1,2,4- triazol- 4- il)- exo- 8- azabicyclo[3.2.1]oct- 8- il]- 1- (3- fluorofenil)propil}- 4,4- difluorociclohexanocarboxamida o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo.
13. Una composición farmacéutica que incluye un compuesto de la fórmula (I) o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de la misma, según se reivindica por cualquier reivindicación anterior, junto con un excipiente, diluyente, o vehículo farmacéuticamente aceptable.
14. Un compuesto de la fórmula (I) o una sal, solvato o composición farmacéuticamente aceptable del mismo, según se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 y 9, respectivamente, para uso como medicamento.
15. Un compuesto de la fórmula (I) o una sal, solvato o composición farmacéuticamente aceptable del mismo, según se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 y 9, respectivamente, para el tratamiento de un trastorno en donde está implicado la modulación de receptores CCR5.
16. Un compuesto de la fórmula (I) o una sal, solvato o composición farmacéuticamente aceptable del mismo, según se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 y 9, respectivamente, para el tratamiento de VIH, una infección retroviral genéticamente relacionado con VIH, SIDA, o una enfermedad inflamatoria.
17. Un compuesto de la fórmula (I) o una sal, solvato o composición farmacéuticamente aceptable del mismo, según se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 y 9, respectivamente, para el tratamiento de un trastorno

respiratorio incluyendo el síndrome de distrés respiratorio adulto, bronquitis, bronquitis crónica, EPOC, fibrosis quística, asma, enfisema, rinitis, o sinusitis crónica.

18. Un compuesto de la fórmula (I) o una sal, solvato o composición farmacéuticamente aceptable del mismo, según se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 y 9, respectivamente, para el tratamiento de una enfermedad intestinal inflamatoria, incluyendo la enfermedad de Crohn o colitis ulcerativa, esclerosis múltiple, artritis reumatoide, rechazo de injertos, incluyendo aloinjertos de riñón o pulmón, endometriosis, diabetes tipo I, una enfermedad renal, pancreatitis crónica, una condición pulmonar inflamatoria, o falla cardíaca crónica.

19. Un proceso para la preparación de un compuesto de la fórmula (I) según se reivindica en la reivindicación 1 el cual comprende:

(a) acoplar un compuesto de la fórmula:



con un compuesto de la fórmula



en donde R^1 y R^2 son tal cual se definen para un compuesto de la fórmula (I); ó

(b) reacción de un compuesto de la fórmula (II) con un compuesto de la fórmula:

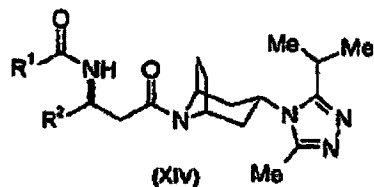


en donde Z es un grupo activador de ácido carboxílico; ó

(c) reducción de un compuesto de a fórmula:

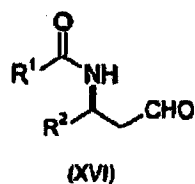
208
208

12

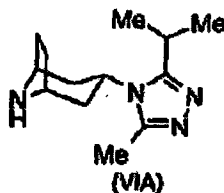


en donde R^1 y R^2 son tal cual se definen para un compuesto de la fórmula (I);

(d) aminación reductiva usando un compuesto de la fórmula:

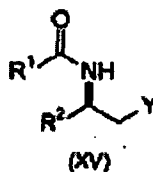


en donde R^1 y R^2 son tal cual se definen para un compuesto de la fórmula (I), y un compuesto de la fórmula:



o una sal del mismo; o

(e) aminación reductiva usando un compuesto de la fórmula:

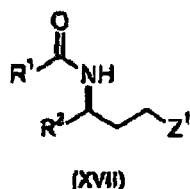


en donde Y es CN y R^1 y R^2 son tal cual se definen para un compuesto de la fórmula (I), y un compuesto de la fórmula (VIA), o una sal del mismo; o

209
209

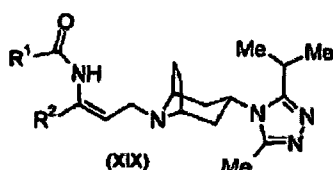
13

(f) alquilación de un compuesto de la fórmula (VIA), o una sal del mismo, con un compuesto de la fórmula:



en donde Z^1 es un grupo saliente y R^1 y R^2 son tal cual se definen para un compuesto de la fórmula (I), o

(g) reducción asimétrica de un compuesto de la fórmula:



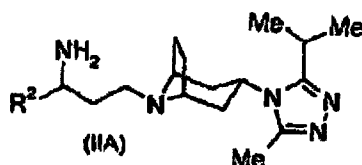
en donde R^1 y R^2 son tal cual se definen para un compuesto de la fórmula (I), o

(h) reacción de un compuesto de la fórmula (II), o una sal metálica del mismo, con un compuesto de la fórmula:



en donde R^1 es tal como se define para un compuesto de la fórmula (I) y R^5 es un grupo formador de ésteres; o

(i) reacción de un compuesto de la fórmula:

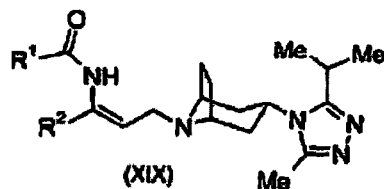
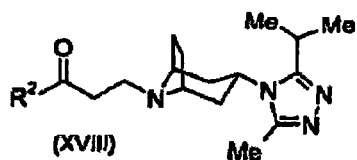
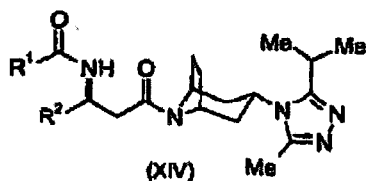
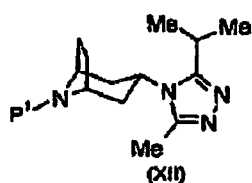
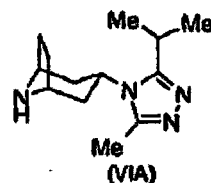
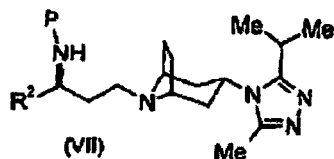
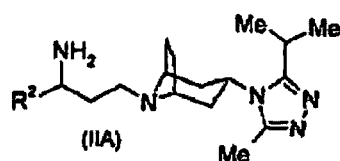
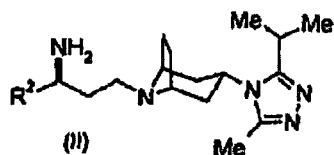


bien sea con un compuesto de la fórmula (III) bajo condiciones de acoplamiento, o con un compuesto de la fórmula (VIB), y en presencia de un catalizador quiral: cualquiera de dichos procesos son seguidos de manera opcionalmente por conversión de un compuesto de la fórmula (I) a un sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

210
210

121

20. Un compuesto empleado en el proceso según se reivindica en 20, que presenta la fórmula:



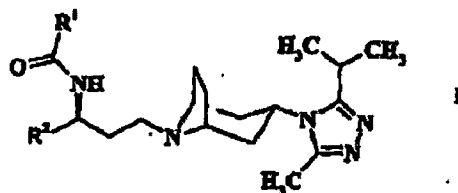
en donde R¹ y R² son tal como se definen en la reivindicación 1, P es un grupo protector, P¹ es un grupo protector; o una sal del mismo del compuesto de la fórmula (VIA), preferiblemente una sal de p- toluenosulfonato.

21. Un compuesto según se reivindicó en la reivindicación 20 en donde R² es fenilo.

22. Un compuesto según se reivindicó en la reivindicación 20 en donde P¹ es bencilo.

23. Un compuesto según se reivindicó en la reivindicación 20 o 21 en donde P es t-butiloxicarbonilo o benciloxicarbonilo.

24. Un compuesto de la fórmula:



en donde R^1 es C_{3-6} cicloalquilo opcionalmente sustituido por uno o más átomos de flúor, o C_{1-6} alquilo opcionalmente sustituido por uno o más átomos de flúor, o C_{3-6} cicloalquilmetilo opcionalmente sustituido en anillo por uno o más átomos de flúor; y

R^2 es fenilo opcionalmente sustituido por uno o más átomos de flúor; o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo, en combinación con uno o más agentes terapéuticos adicionales.

25. Una combinación según la reivindicación 1 en donde el agente terapéutico adicional, o agentes terapéuticos, son seleccionados a partir de aquellos útiles en el tratamiento de enfermedades mediadas por o asociadas con la modulación de receptores de CCR5.

26. Una combinación según la reivindicación 1 ó 2 en donde el agente terapéutico adicional, o agentes terapéuticos, son seleccionados a partir de aquellos útiles en el tratamiento de VIH.

27. Una combinación según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 en donde el agente terapéutico adicional, o agentes terapéuticos, comprende uno o más inhibidores de la proteasa de VIH y/o inhibidores de la transcriptasa inversa de VIH.

28. Una combinación según la reivindicación 4 en donde el uno o más de los inhibidores de la transcriptasa inversa de VIH son seleccionados a partir de la clase de inhibidores de la transcriptasa inversa no- nucleosídicos (NNTRI).

29. Una combinación según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 en donde el agente terapéutico adicional, o agentes terapéuticos, comprende uno o más miembros seleccionados de manera independiente a partir del grupo que consiste de inhibidores de la proliferación, inmunomoduladores, inhibidores de fusión, otros agonistas/antagonistas de receptores de quimiocinas, moduladores del receptor de taquiquinina, inhibidores de la integrasa, inhibidores de RNasaH, inhibidores de la transcripción viral y la replicación de ARN, y otros agentes que inhiben la infección viral o mejoran la condición o resultado de individuos infectados con VIH a través de diferentes mecanismos.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISI3N DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogot3, D.C.,

Abogado
CARLOS R. OLARTE

ASUNTO	Radicaci3n	02-101292
	Tr3mite	002
	Evento	001
	Actuaci3n	430
	Oficio	4 ~~Na~~ 5 9 2 5
	Folios	4

Patente de Invenci3n	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
V3a Nacional	☐		
V3a PCT (fase nacional)	☐	Cap. I	☐
		Cap. II	☒
No. Sol. Internacional	PCT/IB01/00806		
Fecha de Presentaci3n Internal.	Marzo 09 de 2001		

Como resultado del examen de fondo, realizado con fundamento en el art3culo 45 de la Decisi3n 486 de la Comisi3n de la Comunidad Andina, se le comunica:

1. Documentos estudiados

- 1.1. Descripci3n: Folios: 57 a 146 como se radic3 inicialmente
- 1.2. Reivindicaciones: Folios: 147 a 161 como se radic3 inicialmente
Folios: 176 a 189 modificado
Folios: 205 a 211 modificado
- 1.3. Prioridad: Folios: UK No. 0014046.7 del 26 de Mayo de 2000
- 1.4 Respuesta del solicitante Folios: 197 a 211

2. Objeto de la invenci3n

- T3tulo de la solicitud:

"DERIVADOS DE 3-(3-ISOPROPIL-5-METIL-4H-1,2,4-TRIAZOL4-IL)-EXO-8-AZABICICLO [3.2.1] OCTANO, PROCESOS PARA SU PREPARACION, INTERMEDIARIOS EMPLEADOS EN SU PREPARACION Y COMPOSICIONES QUE LOS CONTIENEN" Modificado en folio 198.

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

- Reivindicaciones 1 a 12 y 14 a 18: Compuesto de fórmula (I)
- Reivindicación 13: Composición farmacéutica
- Reivindicación 19: Procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula (I)
- Reivindicaciones de la 20 a la 23: Un compuesto empleado en el proceso de preparación, que presenta la fórmula
- Reivindicaciones de la 25 a la 29: Combinaciones según reivindicación 1 con otros agentes terapéuticos

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de encontrar nuevos compuestos derivados del Tropano, que sirvan como inhibidores para tratar o prevenir la infección por VIH.

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio, suministra compuestos de fórmula (I) y procedimientos para la preparación de los mismos.

- El objeto de la invención definido anteriormente se clasifico de acuerdo con la IPC: A61K 31/46

3. Respuesta a los argumentos del solicitante:

- Se acepta el nuevo capítulo reivindicatorio, presentado por el solicitante.
- Puesto que el solicitante insiste, se aclara que las nuevas Reivindicaciones 24 a 29, no se aceptan ya que corresponden a combinaciones no soportadas en el capítulo descriptivo; además las mismas están siendo caracterizadas como métodos de tratamiento.
- El solicitante hace algunas aclaraciones de acuerdo a lo solicitado en el primer Artículo 45; sin embargo:
 - En el folio 198, dice el solicitante, "... Se incluye la nueva reivindicación 19 que define el proceso para la obtención del compuesto de invención;..."; el mismo corresponde a la reivindicación 27 del capítulo reivindicatorio anterior.
 - En referencia a los términos "opcionalmente" y "uno o más"; se reitera que no son claros. Por tanto en el folio 199, el que refiere el Manual Andino de Patentes el solicitante dice "... que los términos opcionales son perfectamente aceptables en las reivindicaciones y deben entenderse como no limitativos, en particular para la evaluación de la novedad y el nivel inventivo². ..." y el Manual Andino de Patentes, dice ...

4.6.5 *Términos opcionales en una reivindicación*

Expresiones del tipo “preferentemente”, “por ejemplo”, “tal como”, “en especial” precediendo una característica en una reivindicación se deben interpretar como no limitativos, es decir la característica es meramente opcional y no limitada el alcance de la reivindicación (en particular al analizar novedad y nivel inventivo). Si causan confusión en la reivindicación se debe alegar falta de claridad y sugerir que las características opcionales o preferentes se convierten en una reivindicación dependiente.

- Con base a su comentario de los folios 202 y 203, relacionado con el análisis de patentabilidad realizado por otros países; la oficina colombiana comenta que el examen realizado en una u otra oficina de patentes es independiente entre sí, debido al tipo de legislación que se maneja en cada país.

4. De la solicitud de Patente

4.1. Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

- La Reivindicación 1 no es concisa, porque los radicales tienen varios significados, bajo las características esenciales del compuesto de fórmula (I). De otra parte, en la descripción no se encuentra en ninguna parte la formación de solvatos. Los radicales que están soportados en los ejemplos son:

RADICAL	SOPORTE DE LOS EJEMPLOS PRESENTADOS
R ¹	Ciclopropano, ciclopentano, difluorociclohexano y trifluoropropano
R ²	Fenilo y 3-fluorofenilo

- Las Reivindicaciones 14 a 18 reclaman un compuesto de fórmula (I), y el mismo no se encuentra definido por su estructura química sino por sus usos o métodos de tratamiento. Las mismas no se aceptan.
- La Reivindicación 19 desea proteger un proceso para la preparación de un compuesto de fórmula (I), el cual está descrito de forma general y menciona nueve (9) opciones para la obtención del compuesto de fórmula (I); se requiere al solicitante definir los radicales de las fórmulas involucradas de manera inequívoca.
- La Reivindicación 20 dice que depende de la reivindicación 20, la misma no es clara.
- Las Reivindicaciones 24 a 29; están reivindicando una combinación del compuesto de fórmula (1) con otros ingredientes activos; las mismas no se aceptan por no encontrarse soportadas de manera suficiente en el capítulo descriptivo, como también por estar caracterizadas como métodos de tratamiento.
- En las Reivindicaciones de la 1 a 3, 5, 8 a 12, 14 a 18 y 24: las expresiones “opcionalmente”, “uno o más”, “solvato”; no son precisos, por tanto no permiten delimitar la materia a proteger.

Por lo anteriormente expuesto, es preciso requerir al interesado para que señale el verdadero alcance de su invención.