

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
CARLOS R. OLARTE
office@olartemoure.com

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-063882- -00004-0000

Fecha: 2012-11-01 16:01:47 Dep. 2020 DIR.NUEVAS
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONAL
Act. 519 TRASLADOINFORME Folios: 4

ASUNTO	Radicación	11-63882
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	519
	Oficio	
	Folios	4 - - 20129

Patente de Invención ☒ Patente de Modelo de Utilidad ☐

Vía Nacional ☐

Vía PCT (Fase Nacional) ☒ Capítulo I ☒ Capítulo II ☐

No. Solicitud Internacional PCT/IB2009/055043
Fecha de Presentación Internacional 12/11/2009

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 comunica:

1. Documentos estudiados

Descripción:	Folios 65 a 129	24/05/2011
Reivindicaciones:	Folios 129 a 133	24/05/2011
	Folios 140 a 144	12/09/2011
Prioridad:	US 61/117,225	23/11/2008

2. Análisis de la Prioridad

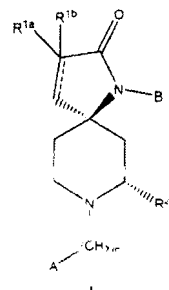
Se acepta la reivindicación de Prioridad porque esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486), y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "NUEVAS LACTAMAS COMO INHIBIDORES DE BETA SECRETASA"

El problema planteado en esta solicitud consiste en suministrar compuestos útiles para tratar procesos patológicos que causan demencia como Alzheimer y angiopatía cerebral amiloide.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona inhibidores de betas secretasa derivados de la fórmula (I).



El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K31/435; A61P25/28; C07D471/10.

4. De la Solicitud de Patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 carece de concisión debido a que los radicales se definen mediante términos funcionales que no limitan el alcance de la solicitud tal como: alquilo, arilo, heteroarilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, alquenilo, -O-alquilo, cicloalquileno y heterocicloalquileno. Adicionalmente, los radicales comprenden un elevado número de sustituyentes los cuales presentan una elevada variabilidad estructural, por lo que no es claro cómo se conserva la actividad de los compuestos reclamados a pesar de las complejas modificaciones propuestas, particularmente para los sustituyentes R^{1a}, R^{1b} y R². Con fundamento en los compuestos ejemplificados y ensayados en la descripción, se encuentra que lo sustituyentes preferidos son:

A es fenil sustituido, piridina sustituida, pirazol sustituido, indol sustituido, tiazol sustituido, indazol sustituido, oxazol sustituido, 3-isopropoxifenil.
B es 3-fluoro fenil, piridina, pirazina, pirazol, tiazol.
R^{1a} R^{1b} son H.
R² es CH₃
n es 1.

En consecuencia, se sugiere restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que ha sido sintetizado o probado, es decir, que se encuentran debidamente sustentados.

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: 23/11/2008, y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2008054698	Spiropiperidine Beta-Secretase Inhibitors For The Treatment Of Alzheimer's Disease	08/05/2008
D2	US5534520	Spiro compounds containing five-membered rings	09/07/1996

D1http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=2008054698A2&KC=A2&FT=D&ND=&date=20080508&DB=&locale=en_EP esta dirigido a espiropiperidinas que son inhibidores de la enzima beta secretasa, útiles en el tratamiento de enfermedades relacionadas con la misma.

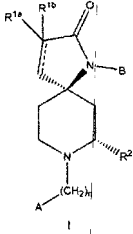
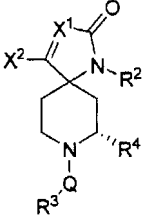
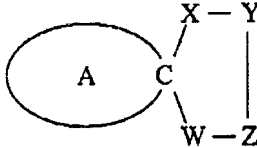
D2<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=US&NR=5534520A&KC=A&FT=D&ND=&date=19960709&DB=&locale=en> EP divulga compuestos espiro que contienen un anillo de cinco miembros útiles en el tratamiento de enfermedades relacionadas con el sistema nervioso central (resumen).

6. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en derivados de lactamas de fórmula (I).

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Características esenciales	D1	D2
	 X^1 es CR^7 donde R^7 es H. (pág. 3, líneas 3 y 4)	 A es un anillo que contiene 1 a 2 átomos de N. Y es $>C=O$ (col. 2, línea 52) W es $>C=CRR'$
A es arilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo o heteroarilo opcionalmente sustituidos	R3 es arilo, cicloalquil C3-12 o heteroaril opcionalmente sustituidos.	No lo divulga
B es alquilo, arilo, heteroarilo, cicloalquilo, o heterocicloalquilo opcionalmente sustituidos.	R2 es C1-10 alquil, C3-12-cicloalquil, heterocicilil, heteroaril (pág. 4, líneas 24 a 33)	X es $>NR^0$, donde R^0 es alquil C1-6 o fenil (Col. 2, líneas 51 y 58 a 61)
R^{1a} R^{1b} son H.	R^7 es H.	Z es $>CRR'$ RR' son H o alquil C1-6 (col. 2 líneas 54 y 58 a 59)
R^2 es CH_3 .	R4 es H, alquil C1-10 (pág. 7, líneas 6 a 8)	No lo divulga
n es 1.	Q es C1-6 – alquil. (pág. 5 línea 30)	No lo divulga.

Los documentos D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque el documento D1 enseña derivados de espiropiperidina útiles como inhibidores de beta-secretasa para el tratamiento de Alzheimer (resumen), en donde X^1 es CR^7 donde R^7 es H (pág. 3, líneas 3 y 4); R3 es arilo; cicloalquil C3-12 o heteroaril opcionalmente sustituidos, cicloalquil, heterocicilil, heteroaril (pág. 4, líneas 24 a 33); R^7 es H, R4 es H, alquil C1-10 (pág. 7, líneas 6 a 8) y Q es C1-6 – alquil (pág. 5 línea 30).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y los compuestos de D1 consiste en que la presente solicitud abarca además de los derivados de espiro pirrolo piperidina, los derivados de pirrolidin-piperidina, y que los derivados de D1 consideran un sustituyente adicional denominado X^2 .

Por su parte, el documento D2 enseña derivados de pirrolidi piperidina tipo espiro útiles para el tratamiento de enfermedades del sistema nervioso central, en donde A es un anillo que contiene 1 a 2 átomos de N; Y es $>C=O$ (col. 2, línea 52); W es $>C=CRR'$; X es $>NR^0$, donde R^0 es alquil C1-6 o fenil (Col. 2, líneas 51 y 58 a 61); Z es $>CRR'$, RR' son H o alquil C1-6 (col. 2 líneas 54 y 58 a 59).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y los compuestos de D2

consiste en que la anterioridad no especifica los sustituyentes del anillo de piperidina de la presente solicitud.

El efecto que logran los derivados de pirrolidin piperidina de la presente solicitud no se puede determinar ya que los resultados de actividad biológica de la tabla 6 no evidencian un efecto superior o inesperado de los derivados de piperidina de la presente solicitud con relación a los compuestos previamente divulgados en el estado de la técnica que resuelven el mismo problema técnico y que son igualmente activos como inhibidores de beta secretasa. Adicionalmente, D1 enseña que los compuestos derivados de espiro piperidina poseen una CI_{50} que se encuentra entre 1nM a 200 μ M (pág. 27, líneas 5 a 8).

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿cómo modificar los derivados de espiro piperidina conocido en D1 para conseguir agentes alternativos como moduladores de beta secretasa?

Sin embargo, los derivados de espiro pirrolidin piperidina útiles para el tratamiento de padecimientos del sistema nervioso central, ya está divulgada en el documento D2.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría el anillo de pirrolidina de D2 en el grupo de derivados de espiro piperidina de D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

De manera que la solución propuesta por esta solicitud en la reivindicación 1 y sus dependientes 2-19, es obvia y no tiene Nivel Inventivo.

7. Conclusión

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

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2008054698	1-19	Nivel Inventivo
D2	US5534520	1-19	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 para dar respuesta a este requerimiento y presentarla por escrito

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)

06 NOV. 2012

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha _____

Elaborado por: Emilce Cano Urrego. 
Revisado por: Jacqueline Alfonso.