

BOGOTÁ - COLOMBIA
OFICINA FUNDADA EN 1941
APARTADO AEREO 12304
TEL: 57-1-3264270 57-1-6069700
FAX: 57-1-3264271 57-1-6069701
CABLES: LLOREDA

Señor
SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
E. _____ S. _____ D. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 03-099663-00006-0000

Fecha: 2007-09-27 16:20:58 Dep. 2020 NUCCREACIONES
Lib. 11 PATENTE (VII) Eje: 379 FASE NACIONAL II
Act. 441 RESPUESTA AL QUE Folios: 9

Re: P1.-F.HOFFMANN-LA ROCHE AG.-Solicitud de Patente de Invención Fase Nacional PCT para "DERIVADOS IMIDAZO[1,5-A]PIRIMIDO[5,4-D][1]BENZAZEPINA COMO MODULADORES DEL RECEPTOR GABA A".- Clase C07D 487/14.-Expediente número 03-099.663.-

1. Me refiero al auto dictado por ese Despacho notificado por fijación en lista de 3 de Agosto de 2007.

2. De acuerdo con el Concepto Técnico número **1125**, el capítulo reivindicatorio de la presente invención no cumple con el requisito de claridad y contiene materia clasificada dentro de las excepciones de patentabilidad. En consecuencia, mediante el presente escrito me permito dar respuesta a las objeciones antes mencionadas, tal como procedo a detallar a continuación.

3. **CLARIDAD DE LA SOLICITUD**

Mediante el Concepto Técnico número **1125** se ha objetado la claridad del capítulo reivindicatorio de la presente solicitud, al considerar que:

- (i) Las reivindicaciones contienen "términos genéricos y además relativos, tales como: alquilo inferior, alqueno inferior, alquilencicloalquilo inferior, cicloalquilo, heteroaromático de cinco miembros";
- (ii) La reivindicación 10 no es clara porque "se encabeza como un producto ya reivindicado y se caracteriza por su uso";
- (iii) La reivindicación 12 no es clara por que la frase "un método equivalente" es "inaceptable en las reivindicaciones"; y
- (iv) Las reivindicaciones 13 a 15 no son claras porque "se encabezan como compuestos ya reivindicados, sin ninguna característica técnica especial, y el texto de la reivindicación se refiere a su utilidad en tratamiento terapéutico".

Sobre este particular, me permito dirigir la atención del señor Examinador a las modificaciones realizadas al texto de las reivindicaciones, de conformidad con los requerimientos anteriormente mencionados. Es así como en el capítulo reivindicatorio se han realizado los siguientes cambios:

- (i) Se han reemplazado las expresiones objetadas "alquilo inferior", "cicloalquilo", "alcoxilo inferior" y "grupo heteroaromático de cinco miembros" por las expresiones "**alquilo de 1 a 7 átomos de carbono**", "**cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono**", "**alcoxilo de 1 a 7 átomos de carbono**" y "**grupo heteroaromático de cinco miembros seleccionado de 1,2,4-oxadiazoles, furilo, pirrolilo, tienilo, imidazolilo, pirazolilo, isotiazolilo o isoxazolilo**", respectivamente. Sobre este particular, me permito señalar que las anteriores modificaciones tienen su sustento en las definiciones proporcionadas en las páginas 4 y 5 del capítulo descriptivo, así como también que las expresiones "alquenilo inferior" y "alquilencicloalquilo inferior" señaladas por el señor Examinador en el Concepto Técnico número **1125** no aparecen dentro del capítulo reivindicatorio de la presente solicitud;
- (ii) Se ha **eliminado** la Reivindicación 10 originalmente presentada;
- (iii) De la misma forma, se ha **eliminado** la expresión "o por un método equivalente" de la reivindicación 12, ahora numerada como reivindicación 11 de conformidad con la modificación anteriormente expuesta; y
- (iv) Finalmente, se han **eliminado** las Reivindicaciones 13, 14 y 15 actualmente presentadas.

Tal como podrá apreciar el señor Examinador, las anteriores modificaciones **no amplían** el alcance de la presente solicitud en concordancia con lo establecido en el Artículo 34 de la Decisión 486, toda vez que las mismas solamente obedecen a dar respuesta a las objeciones expuestas en su Concepto Técnico número **1125** y corresponden, claramente, a una limitación de la materia objeto de la invención tal como fue presentada originalmente. De esta manera, se entienden superadas las objeciones de **claridad** antes mencionadas.

4. **EXCEPCIONES DE PATENTABILIDAD**

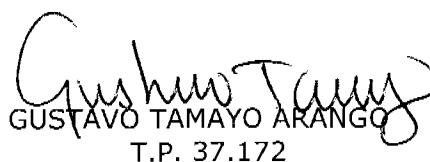
Con el fin de superar la objeción de excepciones de patentabilidad, me permito manifestar nuevamente que, **debidamente autorizado por mí representado**, se han **eliminado** las **reivindicaciones 13, 14 y 15** del capítulo reivindicatorio estudiado, con lo cual se da respuesta efectiva y definitiva a las objeciones que sobre este particular fueron expuestas dentro del Concepto Técnico número **1125**.

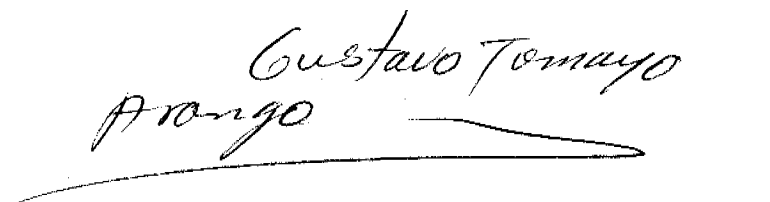
5. Anexo me permito presentar:

- (a) Recibo número 07 - 71,801 expedido por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago de las modificaciones mencionadas; y
- (b) Copia de las páginas 64 a 68, que corresponden al nuevo capítulo reivindicatorio que consta de 11 reivindicaciones y que reemplaza al actualmente presentado, en el cual se han realizado las modificaciones mencionadas anteriormente.

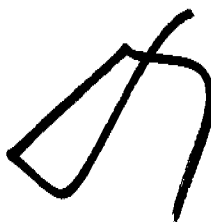
6. En vista de todo lo anterior, ruego a usted proceder a estudiar nuevamente la solicitud a la luz de las argumentaciones presentadas y de las modificaciones realizadas y conceder el privilegio de patente solicitado.

Señor Superintendente,


GUSTAVO TAMAYO ARANGO
T.P. 37.172


CC # 79.152.549
T.P. # 37.172


GUSTAVO TAMAYO
C.C. No. 79.152.549 de Usaquén



139

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 71,801
FECHA : SEPTIEMBRE 6 DE 2007

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
LLDREDA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	47999522	06/09/2007	6,530,200.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	12 MARCAS Y LENAS COMERCIALES
			99,000.00
		TOTAL :	\$ 99,000.00

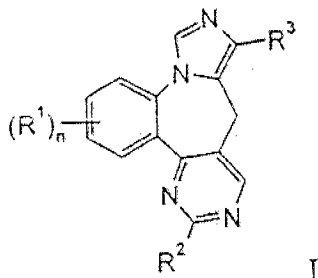
SON: NOVENTA Y NUEVE MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Reivindicaciones

1. Un compuesto de fórmula general



5 en donde

R¹ es halógeno o alquilo de 1 a 7 átomos de carbono;

R² es hidrógeno, alquilo de 1 a 7 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, -(CH₂)_m-fenilo, en donde el anillo fenilo puede estar
10 sustituido por alcóxido de 1 a 7 átomos de carbono, o es -(CH₂)_m-indolilo;

R³ es -C(O)O-alquilo de 1 a 7 átomos de carbono, -C(O)OH, o un grupo heteroaromático de cinco miembros
15 seleccionado de 1,2,4-oxadiazoles, furilo, pirrolilo, tienilo, imidazolilo, pirazolilo, isotiazolilo o isoxazolilo, cuyos anillos pueden estar sustituidos por alquilo de 1 a 7 átomos de carbono o cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono;

n es 0, 1 ó 2;

20 m es 0, 1 ó 2;

y sus sales de adición ácida farmacéuticamente aceptables.

2. Un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R³ es un grupo heteroaromático
25 de cinco miembros seleccionado de 1,2,4-oxadiazoles, furilo, pirrolilo, tienilo, imidazolilo, pirazolilo,

141

isotiazolilo o isoxazolilo, cuyos anillos pueden estar sustituidos por cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono.

3. Un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en que R^3 es el grupo $-C(O)O$ -alquilo de 1 a 7 átomos de carbono, R^1 es hidrógeno y R^2 es tal como se describe en la reivindicación 1.

4. Un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 3, que es

Éster etílico del ácido 9H-imidazo[1,5-a]pirimido[5,4-d][1]benzazepina-10-carboxílico,

Éster etílico del ácido 6-propil-9H-imidazo[1,5-a]pirimido[5,4-d][1]benzazepina-10-carboxílico,

Éster etílico del ácido 6-(1-metiletil)-9H-imidazo[1,5-a]pirimido[5,4-d][1]benzazepina-10-carboxílico,

Éster etílico del ácido 6-ciclopropil-9H-imidazo[1,5-a]pirimido[5,4-d][1]benzazepina-10-carboxílico,

Éster etílico del ácido 6-[(4-metoxifenil)metil]-9H-imidazo[1,5-a]pirimido[5,4-d][1]benzazepina-10-carboxílico o

Éster etílico del ácido 6-metil-9H-imidazo[1,5-a]pirimido[5,4-d][1]benzazepina-10-carboxílico.

5. Un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R^3 es el grupo $-C(O)O$ -alquilo de 1 a 7 átomos de carbono, R^2 es tal como se describe en la reivindicación 1 y R^1 es halógeno.

6. Un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 5, que es

Éster etílico del ácido 3-fluoro-6-metil-9H-imidazo[1,5-a]pirimido[5,4-d][1]benzazepina-10-carboxílico,

Éster etílico del ácido 3-fluoro-6-propil-9H-imidazo[1,5-a]pirimido[5,4-d][1]benzazepina-10-carboxílico,

5 Éster etílico del ácido 3-fluoro-6-(1-metiletil)-9H-imidazo[1,5-a]pirimido[5,4-d][1]benzazepina-10-carboxílico,

Éster etílico del ácido 6-ciclopropil-3-fluoro-9H-imidazo[1,5-a]pirimido[5,4-d][1]benzazepina-10-

10 carboxílico o

Éster etílico del ácido 3-bromo-6-metil-9H-imidazo[1,5-a]pirimido[5,4-d][1]benzazepina-10-carboxílico.

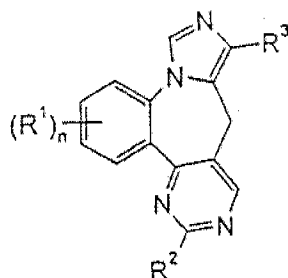
7. Un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R^3 es el grupo 1,2,4-oxadiazolilo o isoxazolilo, sustituido opcionalmente por alquilo de 1 a 7 átomos de carbono o cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, R^2 es alquilo de 1 a 7 átomos de carbono, n es 0 ó 1 y R^1 es halógeno.

8. Un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 7, que es

10-(3-ciclopropil-1,2,4-oxadiazol-5-il)-6-metil-9H-imidazo[1,5-a]pirimido[5,4-d][1]benzazepina o

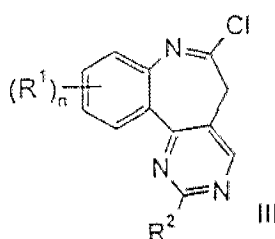
2-bromo-11-metil-7-(5-metil-isoxazol-3-il)-8H-4b,6,10,12-tetraaza-dibenzo[e,g]azuleno.

25 9. Un medicamento que contiene uno o más compuestos de fórmula I tal como se reivindica en las reivindicaciones 1 a 8 y excipientes farmacéuticamente aceptables.



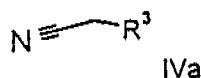
en donde R^1 - R^3 ; y n tienen los significados dados en la reivindicación 1, o

b) reacción de un compuesto de fórmula



5

en donde los sustituyentes R^1 y R^2 y n tienen los significados dados en la reivindicación 1, con



10

para dar un compuesto de fórmula I, o

c) modificar uno o más sustituyentes R^1 - R^3 con las definiciones dadas anteriormente, y

si se desea, convertir los compuestos obtenidos en una sal de adición ácida farmacéuticamente aceptable.

15

11. Un compuesto de fórmula I de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, siempre que se prepare por un proceso tal como se reivindica en la reivindicación 10.

20

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES**

Radicación No. 03-99663

Clasificación Internacional (IPC): A61K31/55

Concepto Técnico No.

Patente de Invención ☒ Patente de Modelo de Utilidad ☐

Vía Nacional ☐

Vía PCT (fase nacional) ☐ Cap. I ☐ Cap. II ☒

No. Sol. Internacional PCT /EP02/05121

Fecha de Presentación Internal. 28/11/2002

Como resultado del examen definitivo, realizado con fundamento en el artículo 48 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

1. Documentos estudiados

1.1. Descripción: Folios: 37 a 100 (como se radicó inicialmente)

1.2. Reivindicaciones: Folios _101_ a _106_ (como se radicó inicialmente)
Folios _140_ a _144_ (después de haberse hecho modificaciones)

1.3. Dibujos: Folios _X_ a _X_ como se radicó inicialmente
Folios _____ a _____ (en caso de haberse hecho alguna modificación teniendo en cuenta además las realizadas en la fase internacional).

2 Objeto de la invención

- Título de la solicitud: "DERIVADOS IMIDAZO[1,5-A]PIRIMIDO[5,4-D]BENZAZEPINA COMO MODULADORES DEL RECEPTOR GABA A"
- El objeto de la presente solicitud se refiere a los derivados de estructura imidazo[1,5,a]pirimido[1,5,d] benzazepina con efecto modulador sobre el receptor gaba A.

evidentemente, por la persona versada en la materia. Por lo tanto tiene nivel inventivo de acuerdo a lo estipulado en el art. 18 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina.

12.3 Aplicación industrial (artículo 19 D 486)

De las reivindicaciones 1 a 11 de los folios 140 a 144. Los derivados de Imidazo[1,5-a] pirimido[5,4-d]benzazepina tal como es reclamado en la presente solicitud, son susceptibles de ser sintetizados, por el método descrito, en las cantidades requeridas por la industria farmacéutica, para producir medicamentos, por lo tanto se considera que tiene aplicación industrial.

En consecuencia y por todo lo expuesto anteriormente, se recomienda **Conceder** las reivindicaciones: 1 a 11 (folios: 140 a 144).

Bogotá, D.C., noviembre 14 de 2007

CONCEPTO TECNICO No 2470	EXAMINADOR TECNICO Código No.12
--------------------------	---------------------------------