

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO			
RAD:	11-149288- -8	FECHA:	2013-01-18 08:46:27
DEP:	2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE:	378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA:	11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS:	6
ACT:	519 PRESENTACION		

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

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

Asunto: Radicación: 11-149288- -8
Trámite: 11
Evento: 378
Actuación: 519
Oficio: 676
Folios: 6

Patente de Invención	X			Patente de Modelo de Utilidad	
Vía Nacional					
Vía PCT (Fase Nacional)	X	Capítulo I	X	Capítulo II	
No. Solicitud Internacional	PCT/US2010/055789				
Fecha de Presentación Internacional	29/04/2010				

1. Documentos estudiados

Descripción:	Folios 136 a 283	Noviembre 3 de 2011
Reivindicaciones	Folios 284 a 288	Noviembre 3 de 2011
Prioridad:	US 61/174,054	Abril 30 de 2009

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

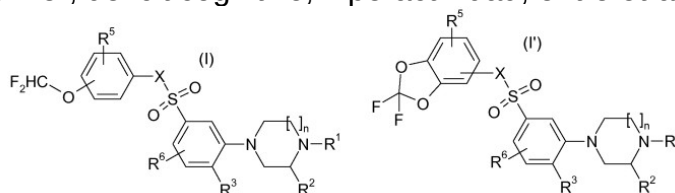
De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del Capítulo Primero del Título 10 de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por el solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es que cuando la solicitud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

Por lo tanto, las reivindicaciones 11 a 37 visibles en los folios 285 a 288 son aceptadas para ser estudiadas, porque se registra el pago por dichas reivindicaciones adicionales, de acuerdo con el recibo presente en el folio 5.

Título de la solicitud: “compuestos de N – fenil – (piperazinil u homopiperazinil) – bencenosulfonamidas o bencensulfonil – fenil – (piperazina u homopiperazina) adecuados para tratar trastornos que responden a la modulación del receptor de serotonina 5 - HT₆ ”

El problema planteado en esta solicitud consiste en obtención de compuestos moduladores del receptor 5 – HT₆, para el tratamiento de trastornos del SNC relacionados con la expresión de este receptor.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio plantea la obtención de compuestos derivados de piperazin u homopiperazin bencenosulfonamidas, con actividad moduladora del receptor 5 – HT₆, para el tratamiento de enfermedades tales como el Alzheimer, déficit cognitivo, hiperactividad, entre otras.



El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K31/495; A61P25/18; A61P25/28; A61P25/30; C07D241/04; C07D295/096; C07D317/06.

4. Excepción a la Patentabilidad (Art 20 D 486, literal d)

El objeto de las reivindicaciones 30 a 37 no es patentable, de acuerdo con el artículo citado.

5. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso (Art 14 y 21 D 486)

El uso de las reivindicaciones 27 y 28 no es patentable, de acuerdo con el artículo 14.

6. De la Solicitud de Patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

El capítulo reivindicatorio no es conciso, porque existen demasiadas reivindicaciones dependientes. Se sugiere consolidar varias de estas reivindicaciones en una sola, de manera tal que el capítulo reivindicatorio posea pocas reivindicaciones y que sean explícitas para determinar cuáles son los compuestos específicos que se desean proteger en esta invención.

Para la reivindicación 1 se solicita nombrar los sustituyentes de forma más específica (por ejemplo, en vez de mencionar “C₃-C₄ cicloalquilo”, mencionar específicamente “ciclopropil o ciclobutil; o en vez de mencionar “C₁-C₂ alquilo fluorado”, mencionar específicamente “fluorometil, difluoroetil, trifluorometil, tetrafluoroetil”; así con los demás sustituyentes), con el fin de establecer cuáles son los compuestos específicos que se consideran como el objeto de esta invención. Se sugiere nombrar dichos sustituyentes de acuerdo a lo soportado dentro del capítulo descriptivo y que se muestran en la siguiente tabla:

Sustituyente	Soportado en la descripción
X	NH, NR ⁴ (R ⁴ es metil, etil, propil, ciclopropilmetil, isopropil), enlace
n	1, 2
R ¹ , R ² y R ⁶	H, CH ₃
R ³	H, CH ₃ , OCH ₃ , OCH ₂ CH ₃ , CH ₂ CH ₃ , F
R ⁵	H, CH ₃ , OCH ₃ , OCF ₂ , Cl, F

Se sugiere que las reivindicaciones 2 a 16 se puedan consolidar en una sola reivindicación, ya que estas en conjunto describen más detalladamente todos los sustituyentes específicos que describen todas las características técnicas que definen la invención.

Para la reivindicación 17, se solicita tener en cuenta la observación realizada anteriormente para la reivindicación 1, de manera tal que se mencionen específicamente los sustituyentes.

De igual manera, las reivindicaciones 18 a 26, se pueden consolidar dentro de una sola reivindicación tal como se sugiere para las reivindicaciones 2 a 16. Sin embargo, se solicita especificar la relación posicional entre X y OCHF₂ en el benceno a una de las tres (ya sea orto, meta o para) con el fin de definir de forma específica los posibles compuestos a proteger en esta invención.

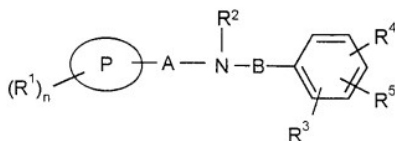
7. Determinación del Estado de la Técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de la cual se invoca prioridad, es decir, el 30 de abril de 2009.

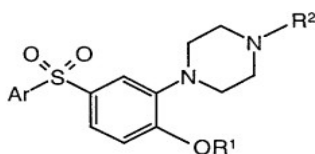
Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud.

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO9902502	"Novel compounds"	Enero 21 de 1999
D2	WO03014097	"Arylsulphonyl derivatives with 5-HT ₆ receptor affinity"	Febrero 20 de 2003

El documento D1¹ divulga compuestos derivados de bencenosulfonilamina, con actividad sobre receptor de 5-HT₆, para el tratamiento de trastornos del SNC.



El documento D2² divulga compuestos derivados de arilsulfonilo, con actividad sobre receptor de 5-HT₆, para el tratamiento de trastornos del SNC relacionadas con este receptor.



8. Examen de Patentabilidad

Nivel Inventivo (Art 18 D 486)

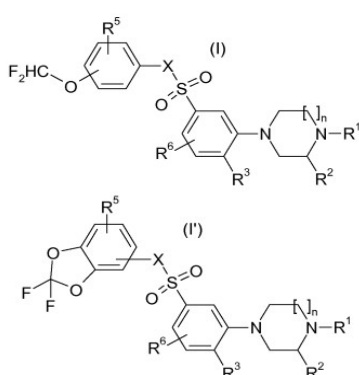
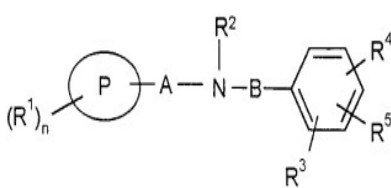
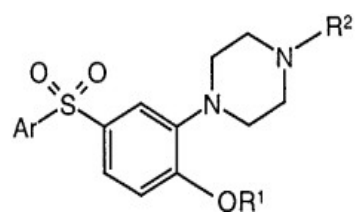
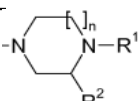
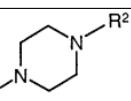
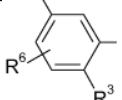
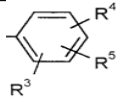
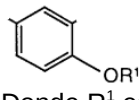
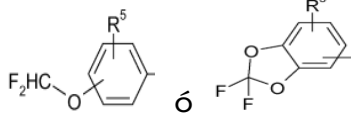
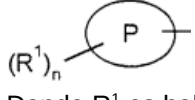
La reivindicación 1 divulga una N – fenil – (piperazin u homopiperazin) – bencenosulfonamidas o bencensulfonil (piperazina u homopiperazina)

1 http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=9902502A2&KC=A2&FT=D&ND=&date=19990121&DB=&locale=en_EP

2 http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?FT=D&date=20030220&DB=&locale=en_EP&CC=WO&NR=03014097A1&KC=A1&ND=1

caracterizadas por las fórmulas (I) o (I') donde... (Folio 284).

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

Solicitud	D1	D2
Compuestos de la Fórmula I o I'  (I) (I')	Compuesto de la Fórmula I  A es un enlace B es SO₂	Compuesto de la Fórmula I 
 Donde R¹ y R² son H o metilo	R⁴ es X – (CH₂)_p – R⁶, donde X es un enlace, p es 0 y R₆ es un heterociclo de 4 a 7 miembros que contiene 1-3 átomos de N (puede ser piperazina u homopiperazina) opcionalmente sustituido por alquilo	 Donde R² es H o C₁₋₆ alquilo
 Donde R³ es H, F, alquilo C₁₋₃, C₁₋₂ alcoxi o C₁₋₂ alcoxi fluorado	 Donde R₄ se definió anteriormente, R₃ es H, halógeno, C₁₋₆ alquilo o C₁₋₆ alcoxi opcionalmente sustituidos por 1 o más átomos de F.	 Donde R¹ es alquilo C₁₋₆.
X es un enlace o NR⁴, donde R⁴ es H, alquilo C₁₋₄.	NR², donde R² es H, alquilo C₁₋₆	Ausente
 Donde R⁵ es H, F, Cl, C₁₋₂ alquilo, C₁₋₂ alquilo fluorado, C₁₋₂ alcoxi o C₁₋₂ alcoxi fluorado	 Donde R¹ es halógeno, alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido por 1 o más átomos de F, C₁₋₆ alquilo, OCF₃. Además, R¹ se puede unir con otro R¹ formando un grupo -O – CH₂ – O- y n va entre 2 y 6.	Ar es fenil opcionalmente sustituido por halógeno o alcoxi C₁₋₆

El Estado de la Técnica D1 se considera el más cercano a la presente invención, porque divulga compuestos derivados de bencenosulfonilamina con actividad sobre receptores de 5 – HT₆ para el tratamiento de trastornos del SNC. (D1: Página 1, líneas 18 – 34 a página 2, líneas 1 – 16 y página 3, líneas 22 y 23).

La diferencias entre la invención y D1 son principalmente que en la invención X aparte de ser NR⁴, X puede ser un enlace, de manera que el grupo SO₂ se une directamente al fenilo, mientras que en D1, necesariamente el grupo B que es SO₂ se une al grupo P que es fenil mediante un grupo NR₂. Además, para la invención, se muestra un sustituyente OCHF₂ o la formación de un anillo -O – CF₂ – O- con el fenil para obtener un anillo de 2, 2 – difluoro benzodioxol, mientras que para D1, aparte de los sustituyentes planteados para R₁, se sugiere que puede ser OCF₃ o que 2 sustituyentes R¹ pueden formar con el fenil P un anillo -O – CH₂ – O- para obtener un anillo de benzodioxol. También la invención divulga uno de los sustituyentes fijos como OCHF₂, mientras que en D1, una de las posibilidades de R¹ es que sea OCF₃.

Estas diferencias parecen no conceder ningún efecto técnico inesperado o ventajoso a los compuestos de esta invención con respecto a lo divulgado en D1.

El Problema Técnico Objetivo que se pretende resolver es el siguiente: ¿Cómo modificar los compuestos divulgados en D1 para obtener nuevos compuestos derivados de (piperazin u homopiperazin) bencenosulfonamidas o sulfonilfenil (piperazina u homopiperazina) con actividad moduladora de receptor de 5 – HT₆ para el tratamiento de trastornos del SNC tales como la enfermedad de Alzheimer, déficit cognitivo, entre otras?

El documento D2 divulga compuestos derivados de sulfonilfenil piperazina, donde el grupo SO₂ se une directamente a un grupo Ar que puede ser fenil (Ver en D2 la página 1, líneas 1 – 8). También, D1 divulga que varios de los sustituyentes alquilo, particularmente R¹, pueden estar sustituidos por 1 o varios átomos de F (ver la página 1, línea 31), teniendo en cuenta que la halogenación de grupos alquilo se constituye como una práctica común en el campo de la síntesis química para la optimización de la actividad de compuestos con alguna clase de actividad farmacológica.

Por lo tanto, una persona versada en la materia y conocedora de los conceptos divulgados en D1 y D2, puede sin ningún esfuerzo obtener los compuestos de D1 y de acuerdo a lo sugerido en D2, puede omitir la inclusión de un grupo amino, de tal manera que el grupo SO₂ se une directamente al grupo fenil. También, teniendo en cuenta que la halogenación de residuos alquilo es una práctica común en la síntesis química de compuestos farmacológicamente activos para optimizar la actividad de los mismos, este mismo experto puede adicionar o sustraer halógenos de residuos alquilo, de manera que a partir de un metilo pueda obtener por ejemplo un grupo CHF₂ o a un grupo enlazante -O – CH₂ – O- para obtener el grupo enlazante -O – CF₂ – O- para sintetizar un anillo de 2, 2 – difluoro benzodioxol a partir del anillo benzodioxol sugerido en D1, para que de esta manera logre sintetizar los compuestos propuestos en esta invención, de manera obvia o evidente.

En consecuencia, la reivindicación 1, de acuerdo a lo divulgado en D1 y D2, carece de Nivel Inventivo.

Las reivindicaciones 2 a 26 y 28, dependientes de la reivindicación 1, no divulgan características inventivas adicionales a los compuestos de la reivindicación 1. Por lo tanto, estas reivindicaciones también carecen de Nivel Inventivo.

9. Conclusión

Los requisitos de Patentabilidad de esta solicitud se ven afectados de la siguiente manera:

Item	Documento	Reivindicaciones	Requisitos que afecta
D1	WO9902502	1 a 26 y 28	Nivel Inventivo
D2	WO03014097	1 a 26 y 28	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 2013-01-22

Elaboró: Dayron Alexander Ramirez Reyes
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Roza