



No. 04-096139- -00005-0000

Fecha: 2008-06-09 16:57:57 Dep. 2020 NUECLACIONE
Tra. 11 PATENTEIIII Eve. 379 FASENACIONALII
Act. 444 RLSPULSTARLQUE Folios: 14

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

Re: Expediente No. 04-096.139

Solicitud de patente titulada: "DERIVADOS DEL TROPANO ÚTILES EN LA
MODULACIÓN DE LOS RECEPTORES CCR5"

Solicitante: PFIZER INC.

N. Ref: P2004/122

RESPUESTA AL OFICIO No 3526 NOTIFICADO POR FIJACION EN LISTA No. 72
DE FECHA 7 DE MARZO DE 2008
(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 fin de brindar mayor claridad a la presente solicitud, me permito presentar un **Capítulo Reivindicatorio Modificado** que reemplaza por completo a aquel presentado en respuesta al Examen de Forma, el 1 de diciembre de 2004, como parte de la traducción del Examen Preliminar Internacional. Por tal motivo adjunto recibo correspondiente a la tasa de modificación.

El Capítulo Reivindicatorio Modificado presenta los siguientes cambios:

277
X

Antigua Reivindicación	Descripción
9	Se elimina la definición de R ⁵ que corresponde a “alcoxi C ₁ -C ₆ sustituido por 0 a 3 átomos de flúor”.
Nuevas Reivindicaciones	Soporte en
10-17	Corresponden a las reivindicaciones 10-17 presentadas al momento de radicar la solicitud.
13	“0 o 3 átomos de flúor” se corrige a “0 a 3 átomos de flúor”, lo que correspondía a un error involuntario, como se evidencia de la lectura de la Reivindicación 14, la cual constituye una limitación de la Reivindicación 13 e indica “0 a 1 átomo...”
18	Corresponde al compuesto del Ejemplo 33.
19	Es el tartrato R, R del compuesto del ejemplo 33, ilustrado en el ejemplo 46.
22	Combinación soportada en la página 25, líneas 25-26.
23	Página 25, líneas 26 a 28.
25 y 26	Página 18, líneas 13 a 15.
29	Página 18 líneas 19 a 21.
30	Página 18 línea 27 a página 19 línea 4.

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 compuestos cobijados bajo la Fórmula I de la reivindicación 1, comprenden sustituyentes con un número de átomos limitado y un número restringido de posibles permutaciones.

2. a- El Examinador establece que los resultados biológicos presentados en la Descripción no son representativos para la gran cantidad de compuestos cobijados bajo la Fórmula I. El Examinador argumenta que dadas las variaciones estructurales permitidas para los compuestos de Fórmula I, no es posible asegurar que todos ellos comparten la misma actividad como moduladores del receptor de CCR5.

b- Con el único propósito de superar la anterior objeción me permito adjuntar al presente memorial la Tabla 1. Los resultados de dicha tabla fueron obtenidos empleando el ensayo gp160 (tal como se publicó en WO2005/033107, página 48), el cual es un ensayo de fusión celular inducida por gp160 para determinar los valores IC₅₀ de los compuestos de la invención frente a la fusión HIV-1. El anterior ensayo exhibe ventajas tales como una mayor velocidad de selección y una sensibilidad incrementada, comparado con el ensayo gp120,

descrito en la presente solicitud. Los resultados de dicho ensayo demuestran que compuestos de la invención que presentan una amplia variabilidad de sustituyentes presentan la actividad declarada. Así pues, que no existen razones para creer que los compuestos que se encuentran dentro del tenor de las reivindicaciones no son activos como moduladores del receptor CCR5, más aún cuando el Examinador no presenta pruebas que soporten tales afirmaciones.

En ese sentido debo subrayar que una práctica aceptable en el ámbito de patentes, es que las nuevas entidades químicas sean sustentadas por una generalización razonable alrededor de los ejemplos, de lo contrario los solicitantes se verían sometidos a una excesiva e indebida carga para proveer una cantidad desmedida e innecesaria de datos. Adicionalmente, es importante aclarar que la Fórmula I reivindicada presenta un número limitado de sustituyentes, que permiten a una persona medianamente versada identificar fácilmente el alcance de la invención.

3. Finalmente deseo poner bajo su conocimiento que las solicitudes equivalentes a la presente solicitud colombiana, fueron concedidas en Europa (EP 1492789) y Estados Unidos (US6855724) y (US7217721).

Si bien es cierto que las concesiones de patentes en oficinas de otros países no son vinculantes en el sentido que obliguen a la Superintendencia a tomar una decisión en el mismo sentido, considero que 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 Superintendencia 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.¹ Igualmente, en materia de criterios de patentabilidad, el Tribunal Andino de

¹ Manual Andino de Patentes. Sección 7.3.

226
4

Justicia ha citado como fuente persuasiva las decisiones de las Cámaras de Apelaciones de la Oficina Europea de Patentes como antecedentes aplicables a la Decisión 486.²

4. Por todo lo anterior, considero que las objeciones presentadas por el Examinador han sido resueltas y por consiguiente solicito respetuosamente se efectúe un segundo examen de fondo, donde se conceptúe acerca de la novedad y nivel inventivo de la presente invención, de lo contrario solicito se tengan por cumplidos todos los requisitos de patentabilidad, 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.
- Ensayo de fusión celular gp160 (contiene Tabla 1).

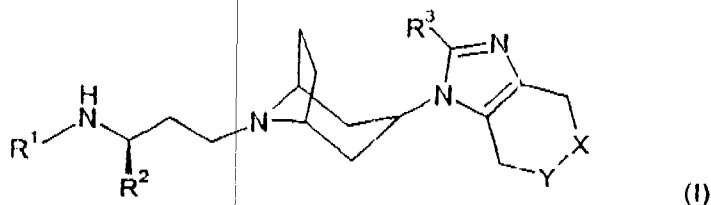
² Ver por ejemplo:

- Proceso 193-IP-2005, página 10, 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”.

22*

CAPITULO REIVINDICATORIO MODIFICADO

1. Un compuesto de Formula (I):



ó una sal ó solvato farmacéuticamente aceptable, o derivados de los mismos en donde:

X y Y están seleccionados de CH₂ y NH₄ como que uno de X y Y están CH₂ y el otro es NH₄;

R₁ y R₄ son independientemente R₅; COR₅; CO₂R₅; CONR₆R₇; SO₂R₅; ó (alquileo C1-6)fenil, en donde fenil es sustituido por 0 a 3 átomos o grupos seleccionados de alquilo C1-6, alquilcarbonil C1-6, alcoxi C1-6, alcoxycarbonil C1-6, halogeno, CF₃, OH, CN, NR₆R₇, COR₇, CO₂R₇ O CONR₆R₇;

R₂ es fenilo sustituido por 0 a 3 átomos o grupos seleccionados de alquil C1-6, alquilcarbonil C1-6, alcoxi C1-6, alcoxycarbonil C1-6, halogeno, CF₃, OH, CN, NR₆R₇, CO₂R₇ ó CONR₆R₇;

R₃ es alquilo C1-4 sustituido por 0 a 3 átomos de fluor;

R₅ es alquilo C1-6; alqueno C2-6; alquino C2-6; cicloalquilo C3-7; de 5 ó 6 miembros heterociclos atomáticos; ó un 4 a 7 miembros heterociclicos saturados; en donde dicho alquilo, alqueno, alquino y cicloalquilo están sustituidos por 0 a 3 átomos o grupos seleccionados de oxo, halogeno, CF₃, OR₇, CN, NR₆R₇, COR₇, CO₂R₇ ó CONR₆R₇; en donde dichos heterociclos contienen de uno a tres heteroatomos seleccionados de N, O ó S; y en donde dichos heterociclos están sustituidos por 0 a 3 átomos o grupos seleccionados de alquil C1-6, alquilcarbonil C1-6, alcoxi C1-6, alcoxycarbonil C1-6, halogeno, CF₃, OH, CN, NR₈R₇, COR₇, CO₂R₇ ó CONR₆R₇;

R₆ es H; alquilo C1-6; alqueno C2-6; alquino C2-6; cicloalquilo C3-7; un heterociclo de 5 ó 6 miembros aromáticos; ó un heterociclo de 4 a 7 miembros saturados; en donde dicho alquilo, alqueno, alquino y cicloalquilo están sustituidos por 0 a 3 átomos o grupos seleccionados de oxo, halogeno, CF₃, OR₇, CN, COR₇ ó CO₂R₇; en donde dichos heterociclos contienen de uno a tres heteroatomos seleccionados de N, O ó S; y en donde dichos heterociclos estan sustituidos por 0 a 3

6

átomos ó grupos seleccionados de alquil C1-6, alquilcarbonil C1-6, alcoxi C1-6, alcoxicarbonil C1-6, halogeno, CF₃, OH, CN, COR₇ ó CO₂R₇;

R₇ es H ó alquilo C1-6;

ó donde R₆ y R₇ están juntos unidos a N átomos, NR₆R₇ pueden solo representar a 5 ó 7 miembros saturados, parcialmente insaturados ó aromáticos, heterociclos que contienen de 0 a 2 heteroátomos adicionales seleccionados de O, N ó S.

2. Un compuesto como se define en la reivindicación 1 en donde X es CH₂, NC₁₋₄ alquil, NCH₂fenil, NCOC₁₋₄ alquil sustituido por 0 a tres átomos de fluor, NCO₂C₁₋₄ alquil ó NSO₂C₁₋₂ alquil.
3. Un compuesto como se define en la reivindicación 1 en donde X es CH₂, NCOC₁₋₂ alquil sustituido por 0 ó tres átomos de fluor, ó NCO₂C₁₋₄ alquil.
4. Un compuesto como se define en cualquiera de las reivindicaciones anteriores en donde, X es CH₂, NCOC₁₋₂ alquil ó NCO₂C₁₋₂ alquil.
5. Un compuesto como se define en la reivindicación 1 en donde Y es CH₂, NC₁₋₆ alquil, N(C₁₋₆ alquilen)fenil, NCOC₁₋₆ alquil sustituido por 0 a tres átomos de flúor, NCO₂C₁₋₆ alquil ó NSO₂C₁₋₄ alquil.
6. Un compuesto como se define en la reivindicación 1 en donde Y es CH₂, NC₁₋₄ alquil, N(C₁₋₄ alquilen)fenil, NCOC₁₋₄ alquil sustituido por 0 a tres átomos de fluor, NCO₂C₁₋₄ alquil ó NSO₂C₁₋₄ alquil.
7. Un compuesto como se define en la reivindicación 1 en donde Y es CH₂, NC₁₋₄ alquil, NCH₂ fenil, NCOC₁₋₄ alquil sustituido por 0 ó tres átomos de fluor, NCO₂C₁₋₄ alquil ó NSO₂C₁₋₂ alquil.
8. Un compuesto como se define en la reivindicación 1 en donde Y es CH₂, NCOC₁₋₂ alquil ó NCO₂C₁₋₂ alquil.
9. Un compuesto como se define en cualquiera de las reivindicaciones anteriores en donde R₁ es COR₅ ó CO₂R₅ y R₅ es, C₁₋₆ alquil sustituido por 0 a 3 átomos de flúor, C₃₋₇ cicloalquil sustituido por 0 a 3 átomos de flúor o heterociclo de 4 a 7 miembros saturado que contiene de 1 a 3 heteroatomos seleccionados entre N, O o S.
10. Un compuesto como los definidos en cualquier reivindicación precedente, en el que R¹ es COR⁵ o CO₂R⁵, en el que R⁵ es un alquilo de C₁₋₄ sustituido con de 0 a 3

átomos de flúor, cicloalquilo de C_{3-5} sustituido con de 0 a 3 átomos de flúor, o un heterociclo saturado de 5 ó 6 miembros, que contiene N, O, o S.

11. Un compuesto como los definidos en cualquier reivindicación precedente, en el que R^1 es COR^5 o CO_2R^5 y R^5 es un alquilo de C_{1-3} sustituido con 0 ó 3 átomos de flúor, cicloalquilo de C_{3-4} , o un heterociclo saturado de 5 ó 6 miembros, que contiene O.
12. Un compuesto como los definidos en cualquier reivindicación precedente, en el que R^1 es un un CO-alquilo de C_{1-2} o un CO_2 -alquilo de C_{1-2} .
13. Un compuesto como los definidos en cualquier reivindicación precedente, en el que R^2 es un fenilo sustituido con 0 ó 3 átomos de flúor.
14. Un compuesto como los definidos en cualquier reivindicación precedente, en el que R^2 es un fenilo sustituido con 0 ó 1 átomos de flúor.
15. Un compuesto como los definidos en cualquier reivindicación precedente, en el que R^2 es un fenilo mono-fluoro-sustituido.
16. Un compuesto como los definidos en cualquier reivindicación precedente, en el que R^3 es un alquilo de C_{1-4} .
17. Un compuesto como los definidos en cualquier reivindicación precedente, en el que R^3 es un metilo.
18. Metil1-endo-{8-[(3s)-3-(acetilamino)-3-(3-fluorofenil)propil]-8-azabicyclo [3.2.1]oct-3-il}-2-metil-4,5,6,7-tetrahidro-1H-imidazo[4,5-c]piridina-5-carboxilato o una sal, solvato o derivado farmacéuticamente aceptable del mismo.
19. Metil1-endo-{8-[(3s)-3-(acetilamino)-3-(3-fluorofenil)propil]-8-azabicyclo [3.2.1]oct-3-il}-2-metil-4,5,6,7-tetrahidro-1H-imidazo[4,5-c]piridina-5-carboxilato (R,R)-tartrato.

6

20. Una composición farmacéutica que incluye un compuesto de la fórmula (I) o una de sus sales, solvatos o derivados farmacéuticamente aceptable, de acuerdo con cualquier reivindicación precedente, junto con uno o más excipientes, diluyentes o vehículos farmacéuticamente aceptables.

21. Una composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 20 que incluye uno o más agentes terapéuticos adicionales.

22. Una composición farmacéutica de acuerdo con las Reivindicación 21 donde el agente terapéutico adicional, o agentes comprenden uno o más inhibidores de VIH y/o inhibidores de la transcriptasa reversa de VIH.

23. Una composición farmacéutica de acuerdo con las Reivindicación 22 donde el uno o más inhibidores de la transcriptasa reversa de VIH se seleccionan de la clase de los inhibidores de transcriptasa reversa no nucleosidos e inhibidores de transcriptasa nucleótidos/nucleosidos.

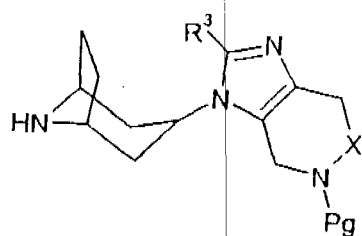
24. Un compuesto de la fórmula (I) o una de sus sales, solvatos o derivados farmacéuticamente aceptables de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 19. para su uso como un medicamento.

25. Un compuesto de Formula (I) o una sal, solvato o derivado farmacéuticamente aceptable del mismo para el tratamiento de un desorden en el cual está implicada la modulación de los receptores CCR5.

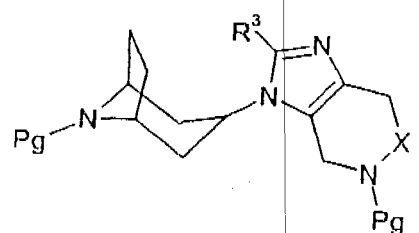
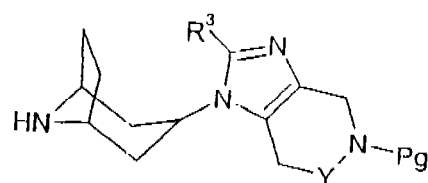
26. Un compuesto de Formula (I) o una sal, solvato o derivado farmacéuticamente aceptable del mismo, de acuerdo con la Reivindicación 25 para el tratamiento de un desorden en el cual está implicada la modulación de los receptores CCR5, donde el desorden es VIH, una infección retroviral genéticamente asociada a VIH, SIDA o una enfermedad inflamatoria.

4

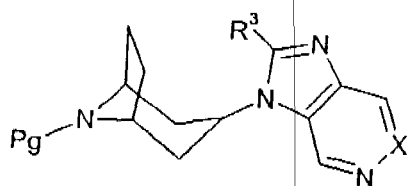
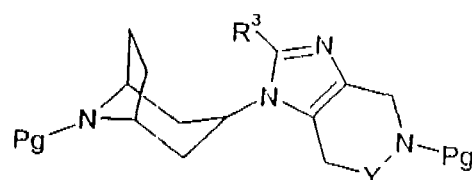
27. Un compuesto de la fórmula (VII), (IX), (XI) o (XIX) en el que X, Y y R³ son como los definidos en la reivindicación 1 para un compuesto de la fórmula (I), y Pg es un grupo protector de un amino.



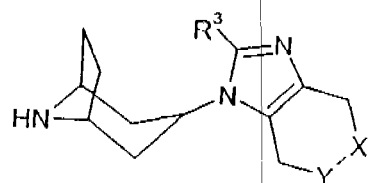
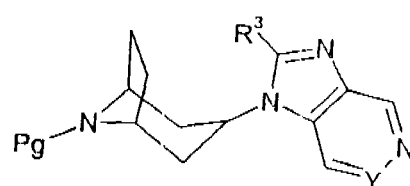
(VII)



(IX)

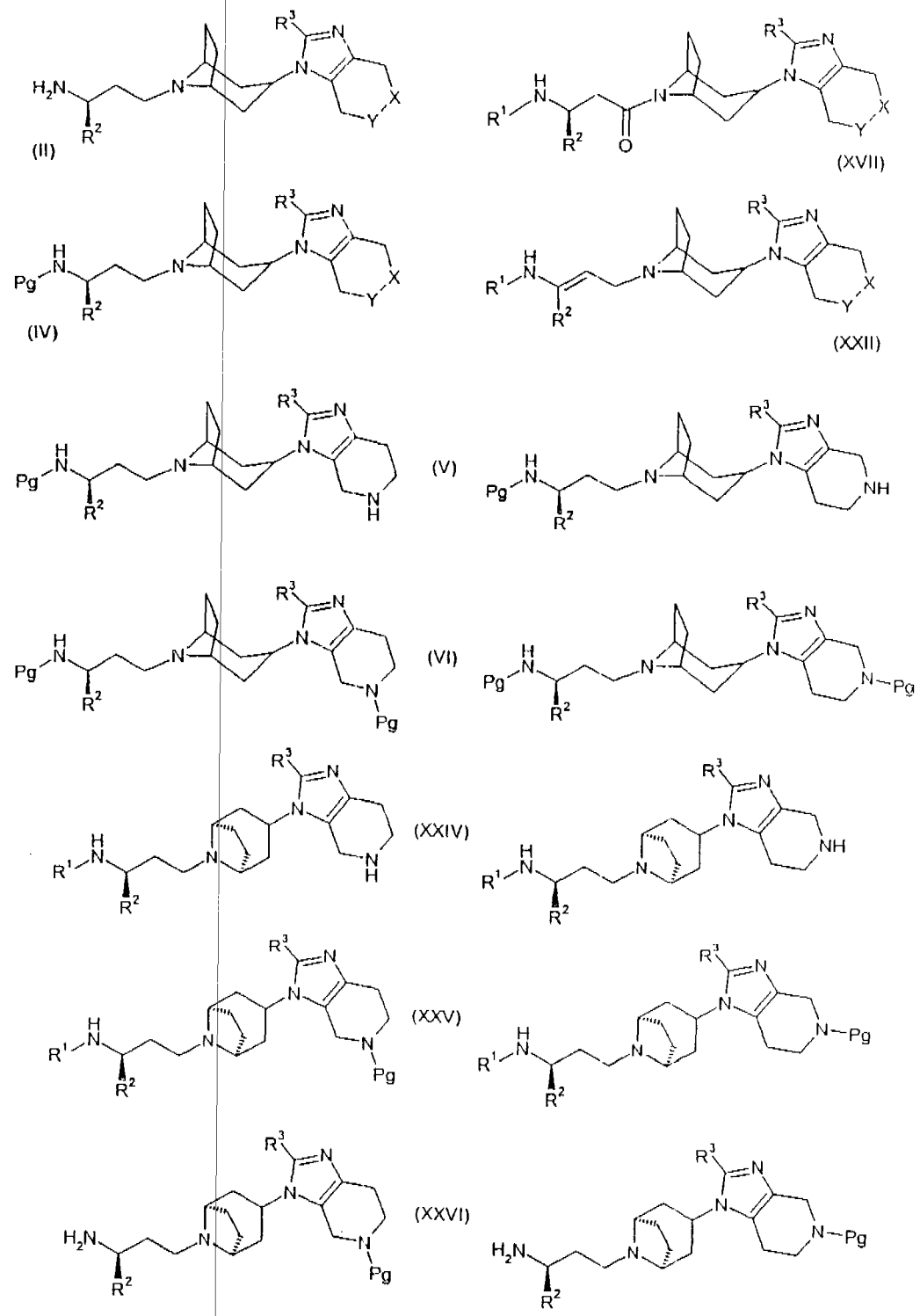


(XI)



(XIX)

28. Un compuesto de la fórmula (II), (IV), (V), (VI), (XXII), (XXIV), (XXV) o (XXVI), en el que X, Y, R¹, R² y R³ son como los definidos en la reivindicación 1 para un compuesto de la fórmula (I), y Pg es un grupo protector de un amino.



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 900176000-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 00 - 44,031
FECHA : JUNIO 4 DE 2008

***** COMERCIO *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VAL. PAGO
CLARITE MATEREX	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	040254387	305833	03/06/2008	-1,507,000.00

***** D E B E T O *****

CANT. DEBITADO	CONCEPTO	TOTAL DEBITADO
1	50005-01-03 CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	12
	MARCAS Y LEHAS COMERCIALES	107,000.00
	TOTAL :	107,000.00

SON: CIENTO TRES MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.

ENSAYO GP160 (COMO SE DIVULGA EN WO05 033107)

La actividad farmacológica de los compuestos de Formula I y de sus sales y solvatos farmacéuticamente aceptables se demostró mediante el ensayo de fusión célula-célula inducida por gp160 para determinar los valores IC50 de los compuestos de la invención frente a la fusión HIV-1. El mencionado ensayo emplea la línea celular HeLa P4 y una línea CHO-Tat10.

La línea celular HeLa P4 expresa CCR5 y CD4 y ha sido transfectada con HIV-1 LTR- β -Galactosidasa. El medio de cultivo empleado para esta línea celular es medio Eagle modificado de Dulbecco (D-MEM) (sin L-glutamina) que contiene 10% de suero fetal bovino (SFB), 2mM de L-glutamina, penicilina/estreptomicina (Pen/Strp; 100U/mL penicilina + 10 mg estreptomicina) y 1 μ g/mL de puromicina.

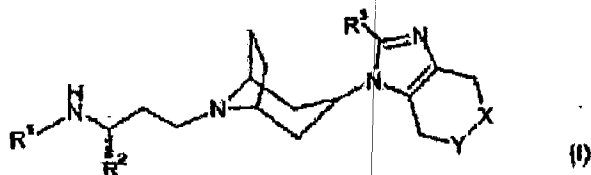
La línea CHO es un clon que expresa el activador de la transcripción *trans* (Tat), a partir de una línea CHO JRR17.1 que ha sido transfectado con el plásmido pTat puro. El medio para esta línea celular es medio enriquecido para cultivo celular de mamíferos desarrollado originalmente en el Roswell Park Memorial Institute RPMI1640 (sin L-glutamina) que contiene 10% de (SFB), 2mM de L-glutamina, 0,5mg/mL de Higromicina B y 12 μ g/mL de puromicina. La línea CHO JRR17.1 expresa gp160 (JRFL) y es un clon seleccionado por su habilidad para fusionarse con una línea celular que expresa CCR5 y CD4.

En relación con la fusión celular, el factor Tat presente en las células CHO es capaz de trans activar las secuencias repetitivas (LTR) presentes en las células Hela, conduciendo a la expresión de la enzima β -galactosidasa. Esta expresión es entonces medida empleando un kit reportero de β -galactosidasa (Bio-Rad Cat. No 170-3150). Este kit es un ensayo fluorescente cuantitativo que determina el nivel de expresión de la β -galactosidasa usando 4-metilumbeliferul-galactopiranosido (MUG) como sustrato. La β -galactosidasa hidroliza el sustrato fluorogénico que resulta en la liberación de la molécula fluorescente de 4-metilumbeliferona (4-MU). La fluorescencia de 4-MU es medida en un fluorometro usando una longitud de onda de excitación de 360nm y una de emisión de 460 nm.

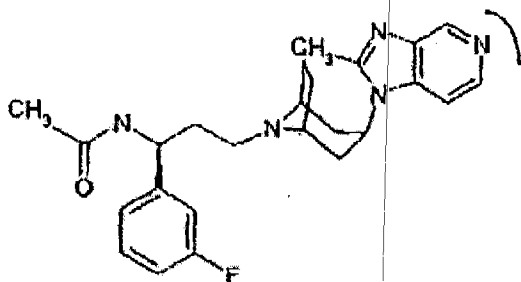
Los compuestos que inhiben la fusión darán lugar a una señal reducida y, tras solubilización en un solvente apropiado y dilución en un medio de cultivo, se puede usar una curva dosis-respuesta para cada compuesto y así calcular el valor IC50.

Datos PC22053

Biological Comparative Data (GP 160 cell fusion assay)



Compound from within the scope of WO 00 38680 (D1) (not specifically disclosed)



There is no
substituent on a
nitrogen atom

Compound described
in Reference 1

Table 1

Examples of Present Application	R ¹	R ²	R ³	X	Y	IC ₅₀ (nM)
7	Ac	Ph	Me	CH ₂	N-COOMe	0.36
13	Ac	3-FPh	Me	CH ₂	N-COOMe	0.12
14	CBuCO	3-FPh	Me	CH ₂	N-COOMe	0.16
15	trifEtCO	3-FPh	Me	CH ₂	N-COOMe	0.3
16	MeOCO	3-FPh	Me	CH ₂	N-COOMe	0.2
25	MeOCO	Ph	Me	CH ₂	N-COOMe	0.15
26	trifEtCO	Ph	Me	CH ₂	N-COOMe	0.1
29	Ac	Ph	Me	N-COOMe	CH ₂	0.07
30	MeOCO	Ph	Me	N-COOMe	CH ₂	0.07
31	CBuCO	Ph	Me	N-COOMe	CH ₂	0.03
32	trifEtCO	Ph	Me	N-COOMe	CH ₂	0.05
33	Ac	3-FPh	Me	N-COOMe	CH ₂	0.03
34	EtCO	3-FPh	Me	N-COOMe	CH ₂	0.02
37	Ac	3-FPh	Me	N-COOMe	CH ₂	0.04
38	Ac	3-FPh	Me	CH ₂	N-COOiPr	0.02
39	Ac	3-FPh	Me	CH ₂	N-COOEt	0.04
40	EtCO	3-FPh	Me	CH ₂	N-COOEt	0.03
Compound described in Reference 1	Ac	3-FPh	Me	pyridine		65

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
CARLOS R. OLARTE

ASUNTO	Radicación	04-96139
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio	31-03-2003
	Folios	4

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Vía Nacional	☐		
Vía PCT (fase nacional)	☒	Cap. I	☐
		Cap. II	☒

No. Sol. Internacional	PCT /IB03/01220
Fecha de Presentación Interna.	31-03-2003

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 le comunica:

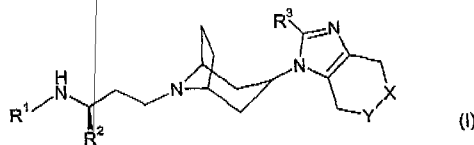
1. Documentos estudiados

- | | | | |
|------|---------------------------|---|-------------------------------|
| 1.1. | <u>Descripción:</u> | Folios: 77 a 189 | (como se radicó inicialmente) |
| 1.2. | <u>Reivindicaciones:</u> | Folios 190 a 195 | (como se radicó inicialmente) |
| | | Folios 213 a 215 | (modificación) |
| | | Folios 227 a 232 | (modificación) |
| 1.3. | <u>Prioridad:</u> | Folio: 1 y 17 | |
| | | Fecha: 8-04-2002; país y número: GB 0208071.1. | |
| | | Folio: 1 y 17 | |
| | | Fecha: 23-01-2003; país y número: GB 0301575.7. | |
| 1.6 | Respuesta del solicitante | Folios: 223 a 226 | |

2. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "DERIVADOS DEL TROPANO UTILES EN LA MODULACIÓN DE LOS RECEPTORES CCR5" (folio: 206)

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



Reivindicaciones 1– 19 y 24-28: Un compuesto de la fórmula (I).

Reivindicaciones 20-23: Una composición que los contiene.

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de compuestos útiles para el tratamiento de los VIH, tales como VIH-1, e infecciones por retrovirus relacionados genéticamente, y enfermedades inflamatorias.

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio proporciona compuestos derivados del tropano.

La invención se catalogó según la Clasificación Internacional de Patentes (IPC.) como: A61K 31/46.

3. De la solicitud de Patente

3.1. Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

Las reivindicaciones 1, 20 y 24 a 26 utilizan la expresión "derivados farmacéuticamente aceptables"; dicha expresión le resta concisión a la solicitud ya que no existe información respecto a cuales pueden ser dichos derivados y los mismos no se encuentran soportados por la descripción.

La reivindicación 1 posee problemas de redacción que le quitan claridad a la solicitud, dichos problemas se presentan en las siguientes frases:

- "como que uno de X y Y están CH2".
- "heterociclos atomaticos; ó un 4 a 7 miembros heterocíclicos saturados".
- "heterociclos de 5 ó 6 miembros aromáticos"
- "Unidos a N átomos"
- "pueden solo representar a 5 ó 7 miembros saturados"

Las reivindicaciones 24 a 26 caracterizan una compuestos por su uso como medicamento para tratar una enfermedad. El uso que se le va a dar a un compuesto no se considera una característica técnica del mismo, por lo que estas reivindicaciones deben modificarse para caracterizar el compuesto de forma correcta.

La reivindicación 27 enseña los compuestos de fórmula (XI), los cuales poseen un anillo imidazopiridina o imidazopiridazina, estos compuestos no se encuentran relacionados con los que se divulgan en la reivindicación (I) ya que el añillo que acompaña al tropano en esta reivindicación es una imidazopiperidina. Por lo tanto no

los compuestos de la fórmula (XI) no son consistentes con el resto de la solicitud y deben retirarse de la misma

Por lo anterior, las reivindicaciones mencionadas no cumplen con el requisito de definición, claridad, concisión o sustento por la descripción de acuerdo al art. 30 de la Decisión 486.y/o art.22 Tratado PCT.

4. Respuesta a los argumentos del solicitante:

El solicitante entrega un nuevo capítulo reivindicatorio contenido en los folios 227 a 232. Luego del estudio de este documento, esta oficina establece que no amplía la materia contenida en la solicitud tal y como fue radicada, por lo cual se acepta para el estudio de patentabilidad.

El solicitante adjunta los resultados del ensayo de gp160 con el cual determina los valores de IC₅₀ de algunos de los compuestos de la invención frente a la fusión HIV-1, los cuales le permiten a esta oficina evidenciar que a pesar de las variaciones en los sustituyentes, los compuestos evaluados conservan actividad frente al receptor CCR5 lo cual sustenta que la tendencia de los derivados de la formula (I) es a actuar sobre dicho receptor.

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 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.

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 N° 10 de 2001.

ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de División de Nuevas Creaciones

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

CONCEPTO TÉCNICO No.1817	EXAMINADOR TÉCNICO Código No. 202073
------------------------------------	--