

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO			
RAD:	12-113850- -3	FECHA:	2014-07-14 09:03:19
DEP:	2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE:	378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA:	11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS:	8
ACT:	519 PRESENTACION		

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
ALICIA LLOREDA RICAURTE

Asunto: Radicación: 12-113850- -3
 Trámite: 11
 Evento: 378
 Actuación: 519
 Oficio: 8504
 Folios: 8

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/EP2010/068912				
Fecha de Presentación Internacional	06/12/2010				

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:	Radicado 12-113850-00000-0000	06/Julio/2012
Reivindicaciones:	Radicado 12-113850-00000-0000	06/Julio/2012
	Radicado 12-113850-00001-0000	31/Julio/2012
Prioridad:	EP 09178893.4	11/Diciembre/2009

2. Análisis de la Prioridad

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

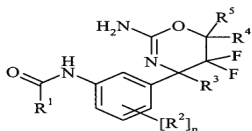
3. Objeto de la invención

De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del Capítulo Primero del Título X 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. Con relación a la presente solicitud se realizó el pago de las reivindicaciones adicionales y se estudiarán las reivindicaciones 1 a 24 de acuerdo con el Radicado 12-113850-00001-0000.

Título de la solicitud: "2-amino-5,5-difluor-5,6-dihidro-4H-oxaxinas como inhibidores BACE 1 y/o BACE 2".

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar compuestos inhibidores BACE-1 y BACE-2, útiles en el tratamiento de enfermedades como el Alzheimer, cáncer, síndrome de Down, esclerosis y la diabetes tipo II.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de fórmula (I) derivado de oxaxinas.



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 265/08, 413/12; A61K 31/535, 31/5355.

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

El objeto de las reivindicaciones 22-24 no es patentable de acuerdo con el Art. citado.

5. De la solicitud de patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 4 no es clara porque el término "opcionalmente" es impreciso, por lo cual no permite distinguir la invención del estado de la técnica. Se sugiere sustituirlo por un término concreto.

La reivindicación 23 no es clara porque no define los ingredientes activos ni los vehículos de formulación por su denominación común internacional y su nombre común, respectivamente. Además, es necesario establecer sus proporciones. Por lo anterior, se sugiere incluir la lista de ingredientes con la participación porcentual de cada uno de éstos.

Las reivindicaciones 1-7 no son concisas porque las definiciones de R1, R2, R3, R4 y R5 son generales se sugiere restringir la solicitud al tipo de sustituyentes que han sido probados, es decir, que se encuentran debidamente sustentados de acuerdo a lo presentado en la tabla No 1.

Tabla No 1 Sustituyentes probados

Sustituyente	Ejemplos probados
R1-R2	
R3-R4-R5	

Se requiere al solicitante hacer las aclaraciones necesarias.

6. 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, diciembre 21 de 2009. Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	EP 1942105	"Aminodihydrothiazine Derivados"	09/Julio/2008
D2	WO 0125229	"Amide compounds"	12/Abril/2001

El documento D1⁽¹⁾ divulga compuestos derivados oxaxinas de con actividad inhibitoria BACE-1, útiles en el tratamiento del Alzheimer (Resumen y Pág. 1, Párrs. [0001 a 0002]).

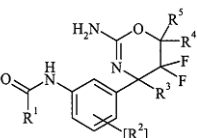
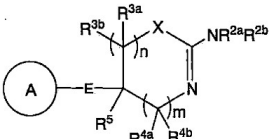
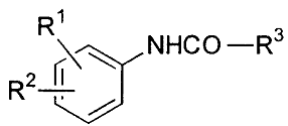
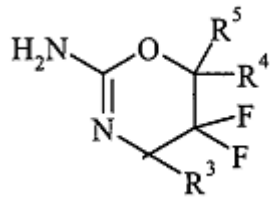
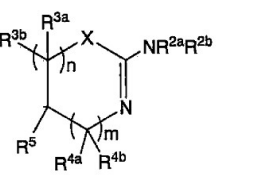
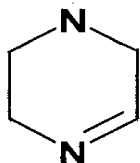
El documento D2⁽²⁾ divulga compuestos derivados de fenilamidas como moduladores de la actividad de los receptores 5HT, útiles en el tratamiento de enfermedades asociadas al sistema nervioso central como la ansiedad, la depresión, el Alzheimer, desordenes del sueño y la bulimia, entre otros. (Resumen y Pág. 1, líneas 1 a 18).

7. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

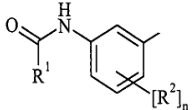
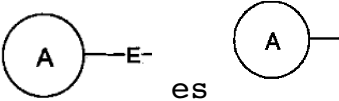
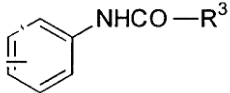
Nivel inventivo (Art18 D486)

Las reivindicaciones 1 y 3 consisten en "Un compuesto de fórmula (I) en la que R1 se elige entre el grupo formado por i) arilo, (...)"

Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica

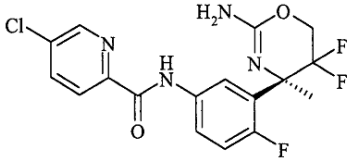
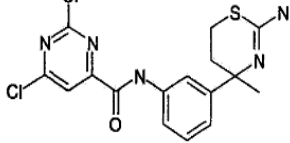
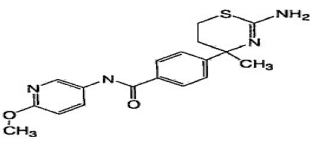
Características esenciales	D1	D2
Compuesto de fórmula (1): 	Compuesto de fórmula (I) [Chemical formula 1]  (Pág. 262-263, Rv. 1)	Compuesto de fórmula (I)  (Pág. 40, Rv. 1)
 R3=Alquilo Inferior R4=Hidrógeno y alquilo inferior R5= Hidrógeno y alquilo	 Donde X=O NR2aR2b R2a y R2b=Hidrógeno R3a=Hidrógeno, alquilo inferior	R1= Heterociclo con Nitrógeno (pirazinilo);  Sustituido con un o más grupos alquilos

1. www.google/patents/EP 1942105
2. www.google/patents/ WO 0125229

inferior	R3b=Hidrógeno, Alquilo inferior R4a=Halógeno R4b=halógeno R5=Hidrógeno y Alquilo inferior n=1 (Pág. 262-263, Rv. 1)	R2=Hidrógeno (Pág. 40, Rv. 1)
 Donde R1= fenilo R2= Hidrógeno, Halógeno n= 0-2	 A= Aril-carbamoilo (Pág. 12, líneas 32-58, Pág. 13, líneas 1-58 y Pág. 262-263, Rv. 1)	 Donde R3=Fenilo (Pág. 40, Rv. 1)

Los documentos D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en las reivindicaciones 1 y 3 porque en el caso del documento D1 divulga compuestos derivados ozaxinas de con actividad inhibitoria BACE-1, útiles en el tratamiento del Alzheimer (Resumen y Pág. 1, Párrs. [0001 a 0002]). Por su lado, el documento D2 divulga compuestos derivados de fenilamidas como moduladores de la actividad de los receptores 5HT, útiles en el tratamiento de enfermedades asociadas al sistema nervioso central como la ansiedad, la depresión, el Alzheimer, desordenes del sueño y la bulimia, entre otros. (Resumen y Pág. 1, líneas 1 a 18).

Los compuestos definidos en la solicitud comparten similitudes estructurales con los compuestos revelados en el documento D1 de acuerdo con lo presentado en el siguiente cuadro

Rv. 16	Compuesto 1273(Pág.204)	D1 Compuesto 1252(Pág.202)
		

La diferencia entre el compuesto, definido en las reivindicaciones 1 y 3 y el compuesto revelado en el documento D1 consiste en que el compuesto reclamado incluye en el grupo carbamoilo como sustituyente un fenilo, mientras que el compuesto divulgado en el documento D1 no incluye sustituyentes en el grupo carbamoilo.

El efecto que logra el incluir como sustituyente del grupo carbamoilo un fenilo, consiste en que se aumenta la actividad BACE-1 y BACE-2.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo proporcionar compuestos alternativos derivados de ozaxinas, útiles en el tratamiento del Alzheimer “.

Sin embargo, la inclusión del fenilo como sustituyente del grupo carbamoilo en compuestos útiles en el tratamiento del Alzheimer, está revelado en el documento D2 que enseña compuestos derivados de fenilamidas sustituidas por fenilos en su grupo carbamoilo, como moduladores de la actividad de los receptores 5HT, útiles en el tratamiento de enfermedades asociadas al sistema nervioso central como la ansiedad, la depresión, el Alzheimer, desordenes del sueño y la bulimia, entre otros. (Resumen y Pág. 1, líneas 1 a 18).

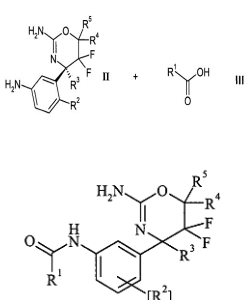
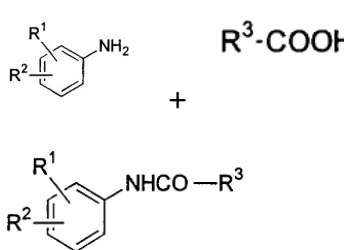
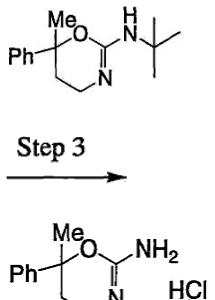
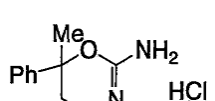
El documento D2 divulga que los compuestos presentan una actividad inhibitoria IC50 BACE comprendida entre 0,027 µM a 8,497µM (Pág. 260, Tabla 170). Por su parte, la solicitud define para los compuestos una actividad IC50 BACE comprendida entre 0,003 a 34,9 µM (Págs 61-76). Por lo anterior, no se observa un efecto técnico sorprendente por parte de la solicitud asociado a la diferencia expuesta.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría como sustituyente del grupo carbamoilo al fenilo de acuerdo con lo divulgado en el documento D2 dentro del grupo carbamoilo del compuesto revelado en el documento D1, para llegar así al objeto de las reivindicaciones 1 y 3 de la solicitud. Por lo cual, se consideras obvias.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2, 4-18 y 21 no mencionan características técnicas esenciales acerca del compuesto reclamado, tampoco se pueden considerar inventivas.

La reivindicación 19 consiste en “Un proceso de obtención del compuesto de la fórmula (I) definido en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 18, dicho proceso consiste en hacer reaccionar un compuesto de fórmula II con un compuesto de fórmula III (...)”.

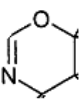
Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica

Características esenciales	D2	D1
Proceso de obtención compuesto de fórmula (I) 	Proceso de Síntesis del compuesto de fórmula (I)  Donde R1= Heterociclo con Nitrógeno (pirazinilo); 	Proceso de síntesis del compuesto 69 y 783  Step 3 

	Sustituido con un o más grupos alquilos R2=Hidrógeno (Pág. 3, líneas 5-25 y Pág. 40, Rv. 1)	
--	---	--

Los documentos D2 y D1 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 19 porque en el caso del documento D2 divulga procesos de síntesis de compuestos derivados de fenilamidas como moduladores de la actividad de los receptores 5HT, útiles en el tratamiento de enfermedades asociadas al sistema nervioso central como la ansiedad, la depresión, el Alzheimer, desordenes del sueño y la bulimia, entre otros. (Resumen y Pág. 1, líneas 1 a 18). Por su lado, el documento D1 divulga procesos de síntesis de compuestos derivados ozaxinas de con actividad inhibitoria BACE-1, útiles en el tratamiento del Alzheimer (Resumen y Pág. 1, Párrs. [0001 a 0002]).

La diferencia entre el proceso de obtención de los compuestos de fórmula (I), definido en la reivindicación 19 y el proceso de obtención de los compuestos de fórmula(I) revelado en el documento D2 consiste en que el proceso de obtención

de los compuestos de fórmula(I) incluye un anillo , mientras que el proceso de obtención de los compuestos divulgados en el documento D2 incluye un anillo .

El efecto que logra el incluir dentro del proceso de obtención de los compuestos

de fórmula (I) un anillo , consiste en que se aumenta el rendimiento del proceso.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo proporcionar procesos de obtención alternativos de compuestos derivados de ozaxinas, útiles en el tratamiento del Alzheimer “.

Sin embargo, la inclusión de un anillo ozaxino en procesos de obtención de compuestos derivados de fenilozaxinas útiles en el tratamiento del Alzheimer, está revelado en el documento D1 que enseña procesos de síntesis de compuestos derivados ozaxinas de con actividad inhibitoria BACE-1, útiles en el tratamiento del Alzheimer (Resumen y Pág. 1, Párrs. [0001 a 0002]).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría el anillo ozaxino de acuerdo con lo divulgado en el documento D1, dentro del proceso de obtención revelado en el documento D2, para llegar así al objeto de la reivindicación 19 de la solicitud. Por lo cual, se considera obvia.

Puesto que la reivindicación dependiente 20 no menciona características técnicas esenciales acerca del proceso de obtención reclamado, tampoco se puede considerar inventiva.

8. Conclusión

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

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	EP 1942105	1-21	Nivel inventivo
D2	WO 0125229	1-21	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 del día siguiente 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 2014-07-22

Elaboró: German Antonio Clavijo Cohen

Revisó: Consuelo Leguizamon Leguizamon