

CAVELIER

ABOGA

EDIFICIO :
CARRERA 4 N.
BOGOTÁ 8, CC

www.cavelier.com
cavelier@cavelier.com

Señora Directora
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-129098- -00007-0000

Fecha: 2010-02-17 16:09:58 Dep: 2020 D. J. ASOR
ID: 11 PATENTUYII Lvs: 379 FASE: NACI. FASE II
Act: 444 RE: SOLICITARELOQUE Edicio: 10

Trámite : 011
Evento : 379
Actuación : 444

Referencia : Expediente No. 05.129.098
Asunto : SOLICITUD DE PATENTE PARA: "MODULADOR DEL RECEPTOR
CANABINOIDE"
Solicitante : TAKEDA PHARMACEUTICAL COMPANY LIMITED
Clase : A61K 031/343, A61K 031/357, A61K 031/381, A61K 031/4025, A61K
031/4178, A61K 031/426, A61K 031/443, A61K 031/453, A61K 031/506,
A61P 003/004, A61P 011/006, A61P 025/000, A61P 025/008, A61P
027/006, A61P 043/000, CO7D 307/079, CO7D 333/054, CO7D 405/004,
CO7D 405/006, CO7D 405/010, CO7D 407/004, CO7D 409/004
Fecha de solicitud : Diciembre 22 de 2005

1. Yo, Luz Clemencia DE PÁEZ, en mi condición de apoderada de la sociedad solicitante de la patente de la referencia, me refiero al Oficio No. 11343 notificado por fijación en lista del 9 de octubre de 2009.

2. Mediante el Oficio No. 11343 se puso en conocimiento del solicitante el informe del examen de fondo que contiene las observaciones hechas por su Despacho sobre la presente solicitud de patente. Con memorial radicado el 5 de Enero de 2010, solicité plazo de treinta (30) días para atender el oficio No. 11343. Al respecto, atiendo a las observaciones de la siguiente manera:

3. Claridad del capítulo reivindicatorio:

3.1 Con relación a la objeción realizada por su Despacho sobre la ausencia de claridad del capítulo reivindicatorio y con fundamento en lo establecido en el artículo 34 de la Decisión 486, se presenta un nuevo capítulo reivindicatorio como sustituto del anteriormente presentado

compuesto por treinta y tres (33) reivindicaciones, los cambios realizados al nuevo pliego reivindicatorio son:

3.1.1 Se borran las anteriores reivindicaciones 1 a 12, 14, 18, 23, 24 y 50 a 55.

3.1.2 Se redacta una nueva reivindicación 1 con el contenido de la anterior reivindicación 13 y se limita de acuerdo al contenido de la descripción y específicamente de los ejemplos de la presente solicitud

4. NOVEDAD Y NIVEL INVENTIVO

Ese Despacho cita una serie de documentos y concluye que la presente solicitud no cumple con el requisito del artículo 16 de la Decisión 486. Sin embargo, al tener en cuenta el nuevo capítulo reivindicatorio, podemos ver que la materia revelada por el actual pliego reivindicatorio es novedosa sobre la técnica anterior citada. En particular:

4.1 D1: EP0483772. R¹ y R² de la presente solicitud se limitan a un átomo de hidrógeno o metilo. Mientras que en la reivindicación 1 de D1, R⁶ y R⁷ correspondientes a R¹ y R² de la presente invención, están definidos de la siguiente forma:

"R⁶ y R⁷ son los mismos o diferentes y son un grupo alifático opcionalmente sustituido, en donde al menos uno de R⁶ o R⁷ tiene metileno en la posición α ".

Por lo tanto, el compuesto de la presente invención difiere de D1 porque los radicales R¹ y R² de la presente solicitud *no tienen metileno en la posición α* .

4.2 D2: WO95/29907. El radical R^{6'} de la presente solicitud es alquilo C1-6, alcoxi C1-6, alquilamino C1-6, cicloalquilamino C3-6 o di-alquilC1-6amino. Por otro lado, en la reivindicación 1 de D2 el radical Z, correspondiente a R^{6'} de la presente invención, no es un grupo heterocíclico o aro. Por lo tanto, el compuesto de la presente invención difiere de D2 porque el radical R^{6'} de la presente solicitud no es un grupo heterocíclico o aro.

4.3 D3: US5496853. El radical R^{4'} de la presente invención es un aro C6-14 o un grupo heterocíclico, mientras que la parte correspondiente del compuesto de D3 (es decir R⁵ ó R⁶) es

un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-20. Por lo tanto, el compuesto de la presente invención difiere del presentado en D3.

4.4 D4: WO96/07651. El radical R4' de la presente invención esta limitado a arilo C6-14 o a un grupo heterocíclico, mientras que el radical Y de D4, correspondiente a R4' de la presente solicitud, es hidrógeno o alquilo (incluyendo cicloalquilo). Por lo tanto, el compuesto de la presente solicitud es diferente de D4.

4.5 D5: WO96/07651 y D7: US6172085 (D7 es de la familia de D5). Los compuestos de D5 y D7 tienen metilénpiperazina o un grupo metilénpiperidina como grupo correspondiente a los radicales R1 o R2 de la presente invención. Mientras que los radicales R1 y R2 de la presente solicitud son un átomo de hidrógeno o metilo. Por lo tanto, el compuesto de la presente solicitud difiere de D5 y D7.

4.6 D6: EP1136477 y D8: EP1323716. El compuesto de la presente invención no tiene un arilo C6-14-alquiloC1-6 como R6' porque dicho sustituyente fue borrado de la definición de R6' luego de corregido. Por otro lado, aunque un grupo acilo esté definido en R5 de D6 y D8, el cual es correspondiente a R6'-Y- de la presente invención, todos los compuestos de dichas anterioridades solo tienen arilo o un arilo sustituido como el grupo correspondiente a R6' de la presente invención (ver tabla 4-6 de D6 y tabla 3-5 de D8). Por lo tanto, el compuesto de la presente invención no se menciona de forma específica en dichos documentos D6 y D8.

Teniendo en cuenta que de acuerdo con el Manual Andino de Patentes, un documento del estado del arte solamente puede afectar la novedad de una invención cuando describe o revela explícitamente todas las características técnicas de la misma, es claro que los documentos citados no son anterioridades válidas capaces de afectar la novedad de la presente invención por no revelar todas y cada una de las características técnicas de la invención reivindicada.

4.7 Con respecto al Nivel inventivo respetuosamente solicitamos tener en cuenta que tal y como se muestran en los datos de los ejemplos experimentales 1 y 2 (tablas 8 y 9) y en el ejemplo experimental 3, el compuesto de la presente invención tiene efectos inesperados como son: una excelente afinidad al receptor canabinoide, una acción de disminución de temperatura del cuerpo y reducción del efecto de infarto cerebral local, el cual no se enseña o sugiere en los documentos citados por su Despacho.

2042
2027

Así entonces, el efecto inesperado del compuesto acá reivindicado se constituye en la prueba de su nivel inventivo de acuerdo con el Manual Andino de Patentes y por ende la objeción formulada a este respecto se debe tener por superada.

Puesto que se han atendido a cabalidad las observaciones hechas por su Despacho sobre la presente solicitud de patente, respetuosamente solicito se continúe con su tramitación.

5. Anexos:

- Nuevo pliego reivindicatorio conformado por treinta y tres (33) reivindicaciones.
- Formulario para modificaciones.
- Comprobante de pago por 23 reivindicaciones adicionales después de la décima reivindicación por \$598 000.

Señora Directora,

Luz Clemencia de Páez
LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ
T.P.A. No. 23.555

COLO-14656-841-006-3
LMAILMAD-165791WPC14656
No. M-2010-165791LMA

2043

2048



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

Espacio reservado para el adhesivo de radicación

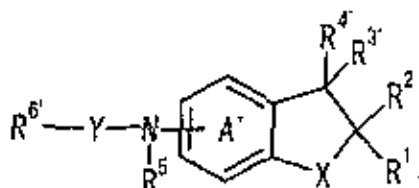
FORMULARIO UNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

1	SOLICITUD DE: ☐ Corrección de Error Material ☒ Modificación a una solicitud																	
2	SOLICITANTE Nombre: TAKEDA PHARMACEUTICAL COMPANY LIMITED Sociedad constituida y existente bajo las leyes de Japón. Dirección: 1-1, Doshomachi 4-chome, Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka Japón Domicilio: Osaka Japón Teléfono: 546 09 70 Fax: 249 40 70 E-mail: clientes@cavelier.com	IDENTIFICACION C.C. ☐ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Número: _____																
3	REPRESENTANTE O APODERADO Nombre: Luz Clemencia de PAEZ Dirección: Carrera 4ª No. 72-35 Teléfono: 347 36 11 Fax: 217 92 11 E-mail: cavelier@cavelier.com	IDENTIFICACION C.C. ☒ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Número: 35.456.344 TP 23.555																
4	Número de expediente: 05.129.098																	
5	Descripción de la corrección o modificación solicitada: Presento nuevo capítulo reivindicatorio compuesto por 33 reivindicaciones con el fin de superar las objeciones hechas por Su Despacho a la presente solicitud de patente y pido respetuosamente que el examen de patentabilidad sea realizado sobre estas nuevas reivindicaciones presentadas.																	
6	<table border="0"> <tr> <td>Comprobante de pago No.</td> <td><u>10-4.241</u></td> <td>Fecha:</td> <td><u>18 de enero de 2010</u></td> </tr> <tr> <td>Comprobante de pago No.</td> <td><u>10-7.951</u></td> <td>Fecha:</td> <td><u>01 de febrero de 2010</u></td> </tr> <tr> <td>Comprobante de pago No.</td> <td><u>10-9.649</u></td> <td>Fecha:</td> <td><u>08 de febrero de 2010</u></td> </tr> <tr> <td>Comprobante de pago No.</td> <td><u>10-12.281</u></td> <td>Fecha:</td> <td><u>15 de febrero de 2010</u></td> </tr> </table>		Comprobante de pago No.	<u>10-4.241</u>	Fecha:	<u>18 de enero de 2010</u>	Comprobante de pago No.	<u>10-7.951</u>	Fecha:	<u>01 de febrero de 2010</u>	Comprobante de pago No.	<u>10-9.649</u>	Fecha:	<u>08 de febrero de 2010</u>	Comprobante de pago No.	<u>10-12.281</u>	Fecha:	<u>15 de febrero de 2010</u>
Comprobante de pago No.	<u>10-4.241</u>	Fecha:	<u>18 de enero de 2010</u>															
Comprobante de pago No.	<u>10-7.951</u>	Fecha:	<u>01 de febrero de 2010</u>															
Comprobante de pago No.	<u>10-9.649</u>	Fecha:	<u>08 de febrero de 2010</u>															
Comprobante de pago No.	<u>10-12.281</u>	Fecha:	<u>15 de febrero de 2010</u>															
7	Anexos ☐ Comprobante de pago de la tasa por \$114.000, por concepto de modificaciones. ☒ Comprobante de pago por 23 reivindicaciones adicionales después de la décima reivindicación por \$598.000.00. ☐ Poderes, si fuere el caso																	
8	NOMBRE: LUZ CLEMENCIA DE PAEZ FIRMA: <u>Luz Clemencia Paez</u> C.C. 35.456.344 de Usaquén T.P.A. 23.555																	

LMA

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto representado por la fórmula (I')



caracterizado porque, X es un átomo de oxígeno, R¹ y R² son independientemente (1) un átomo de hidrógeno ó metilo, R³ es (1) un átomo de hidrógeno, (2) un alquilo C₁₋₄ ó (3) hidroxí, R⁴, es (1) arilo C₆₋₁₄ que puede estar sustituido por (a) un átomo de halógeno, (b) alquilendioxi C₁₋₃, (c) grupo alquilo C₁₋₄ que puede estar sustituido por hidroxy, (d) alquenil C₂₋₈, (e) cicloalquil C₃₋₆, (f) arilo C₆₋₁₄, (g) grupo alcoxi C₁₋₄ que puede estar sustituido por (i) átomo de halógeno ó (ii) alcoxi-carbonilo C₁₋₈, (h) hidroxí, (i) formilo ó (j) alquil-carbonilo C₁₋₈, ó

(2) un grupo heterocíclico seleccionado entre tienilo, furilo, piridilo que puede estar sustituido por (a) alquilo C₁₋₆, (b) piperidilo o (c) pirrolidinilo,

Y es -CO- ó -SO₂-,

R⁵ es (1) un átomo de hidrógeno o (2) alquilo C₁₋₈,

R⁶ es (1) un grupo alquilo C₁₋₆ que puede estar sustituido por (a) un átomo de halógeno, (b) hidroxí ó (c) ciclo amino saturado de 5-7 miembros,

(2) alcoxi C₁₋₈ que puede estar sustituido por un átomo halógeno,

(3) alquilamino C₁₋₈ que puede estar sustituido por (a) alcoxi C₁₋₆, (b) hidroxí ó (c) di-alquilamino C₁₋₈,

(4) cicloalquilamino C₃₋₆, ó

(5) di-alquilamino C₁₋₈, y el anillo A' es un anillo de benceno el cual puede además tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste de

(1) un átomo halógeno,

(2) dihidroxiborilo,

(3) grupo alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido por hidroxí, di-alquilamino C₁₋₈, pirrolidino-1-ilo,

(4) alquenil C₂₋₈,

(5) grupo arilo C₆₋₁₂ opcionalmente sustituido por (a) átomo halógeno, (b) nitro, (c) alquil C₁₋₈, (d) alcoxi C₁₋₈, (e) amino, (f) di-alquilamino C₁₋₆, (g) alquil-carbonilo C₁₋₈, (h) alcoxi-carbonilo C₁₋₈, (i) alquilo-carbonilamino C₁₋₈ ó (j) pirrolidin-1-ilo,

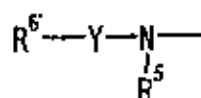
(6) aralquil C₇₋₁₄ que puede estar sustituido por (a) alquil C₁₋₈, (b) hidroxí ó (c) pirrolidinilo,

(7) grupo heterocíclico de 5 ó 6 miembros opcionalmente sustituido por (a) átomo de halógeno, (b) alquilo C₁₋₈, (c) alcoxi C₁₋₆, (d) amino, (e) di-alquilamino C₁₋₈ ó (f) alquil-carbonilamino C₁₋₈,

(8) un grupo acilo seleccionado entre el grupo que consiste de formilo, carboxilo, alquil-carbonilo C₁₋₈ y aril-carbonilo C₆₋₁₄.

(9) alcoxi C₁₋₈, ó

(10) ariloxi C₆₋₁₄ que puede estar substituido por alquilo C₁₋₈, en adición a un grupo representado por la siguiente fórmula



en donde, cada uno de los símbolos tiene el mismo significado como se describe arriba, o una sal del mismo.

2. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque R¹ y R² son un átomo de hidrógeno.

3. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque R¹ y R² son respectivamente un átomo de hidrógeno o metilo, con la condición de que R¹ y R² no son un átomo de hidrógeno al mismo tiempo.

4. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque R³, es un átomo de hidrógeno.

5. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque R⁴ es un grupo fenilo que puede estar substituido por (a) un átomo halógeno, (b) alquilenodioxí C₁₋₃, (c) grupo alquilo C₁₋₄ que puede estar substituido por hidroxí, (d) aluenil C₂₋₆, (e) cicloalquilo C₃₋₆, (f) arilo C₆₋₁₄, (g) grupo alcoxi C₁₋₄ que puede estar substituido por (i) un átomo halógeno ó (ii) alcoxi-carbonilo C₁₋₈, (h) hidroxí, (i) formilo ó (j) alquil-carbonilo C₁₋₈.

6. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque R⁴ es un grupo fenilo el cual puede ser substituido por (a) un grupo alquilo C₁₋₄ que puede estar substituido por hidroxí ó (b) un grupo alcoxi C₁₋₄ que puede estar substituido por (i) un átomo halógeno.

7. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque Y es -CO-.

8. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque R⁵ es un átomo de hidrógeno.

9. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque la posición 7 del heterociclo fusionado está además substituida por un grupo arilo C₆₋₁₄-alquilo C₁₋₄.

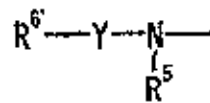
10. El compuesto como se describe de conformidad con la reivindicación 9, caracterizado porque el grupo arilo C₆₋₁₄ alquilo C₁₋₄ es un grupo bencilo substituido por alquilo C₁₋₆ ó hidroxí.

11. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque el anillo A' es un anillo de benceno el cual puede además tener 1 a 3 substituyentes seleccionados del grupo que consiste de (1) alquilo C₁₋₆ opcionalmente substituido por hidroxí, di-alquil C₁₋₆ amino, pirrolidin-1-ilo ó 2-piridilo,

(2) grupo arilo C₆₋₁₂ opcionalmente substituido por (a) átomo halógeno, (b) nitro, (c) alquil C₁₋₆, (d) alcoxi C₁₋₆, (e) amino, (f) di-alquil C₁₋₆ amino, (g) alquilo C₁₋₆ carbonilo, (h) alcoxi C₁₋₆ carbonilo, (i) alquilo C₁₋₆ carbonilamino ó (j) pirrolidin-1-ilo,

(3) un grupo heterocíclico de 5 ó 6 miembros opcionalmente substituido por (a) átomo halógeno, (b) alquilo C₁₋₆, (c) alcoxi C₁₋₆, (d) amino, (e) di-alquil C₁₋₆ amino ó (f) alquil C₁₋₆ carbonilamino, y

(4) un grupo acilo seleccionado entre el grupo que consiste de formilo, carboxilo, alquil C₁₋₆ carbonilo y aril C₆₋₁₄ carbonilo, en adición a un grupo representado por la siguiente fórmula



en donde, cada uno de los símbolos tiene el mismo significado como se describe arriba.

12. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque la posición 7 del heterociclo fusionado es substituido por un grupo alquilo C₁₋₄, un grupo arilo C₆₋₁₂, un grupo heterocíclico de 5 ó 6 miembros o un grupo acilo seleccionado entre el grupo que consiste de formilo, carboxilo, alquil C₁₋₆ carbonilo y arilo C₆₋₁₄ carbonilo.

13. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque la posición 7 del heterociclo fusionado está substituida por (a) un grupo fenilo opcionalmente substituido por un átomo de halógeno, nitro, alquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆ amino, di-alquilo C₁₋₆ amino, alquilo C₁₋₆ carbonilamino ó pirrolidin-1-ilo,

(2) un grupo furanilo, (3) un grupo tienilo, (4) un grupo piridilo opcionalmente substituido por un átomo de halógeno, alquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, amino, di-alquilo C₁₋₆ amino ó alquilo C₁₋₆ carbonilamino, (5) un grupo acetilo, (6) un grupo propionilo, (7) un grupo butirilo, o (8) un grupo benzoilo.

14. N-(3-(4-isopropilfenil)-4,6,7-trimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida,
(+)-N-((3R)-3-(4-isopropilfenil)-4,6,7-trimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida,

N-(7-acetil-3-(4-isopropilfenil)-4,6-dimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-

dimetilbutanamida,

N-(3-(4-isopropilfenil)-7-metoxi-4,6-dimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida,

(+)-N-((3R)-7-acetil-3-(4-isopropilfenil)-4,6-dimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida,

(+)-N-(tert-butil)-N'-((3R)-3-(4-isopropilfenil)-4,6,7-trimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)urea,

N-(3-(4-isopropilfenil)-4,6-dimetil-7-fenil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida,

N-(7-(3-dimetilaminofenil)-3-(4-isopropilfenil)-4,6-dimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida,

N-(3-hidroxipropil)-N'-((3R)-3-(4-isopropilfenil)-4,6,7-trimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)urea,

N-((4-isopropil-3-(2-metoxietoxi)-fenil)-4,6,7-trimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida,

N-(7-(4-isopropilbencil)-3,4,6-trimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida,

N-(3-(4-tert-butilfenil)-2,2,4,6,7-pentametil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida,

N-(3-(4-isopropilfenil)-4,6,7-trimetil-3H-espiro(1-benzofuran-2,1'-ciclopentan)-5-il)-3,3-dimetilbutanamida,

N-(3-(4-isopropilfenil)-4,6-dimetil-7-propil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida,

(+)-N-((3R)-7-(1-hidroxietil)-3-(4-isopropilfenil)-4,6-dimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida,

N-(7-(6-fluoropiridin-3-il)-3-(4-isopropilfenil)-4,6-dimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida,

N-(7-(3-furil)-3-(4-isopropilfenil)-4,6-dimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida,

N-(7-hidroxi-3-(4-isopropilfenil)-4,6-dimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida, o

N-(7-etoxi-3-(4-isopropilfenil)-4,6-dimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida.

15. N-(3-(4-isopropilfenil)-4,6,7-trimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida ó una sal del mismo.

16. (+)-N-((3R)-3-(4-isopropilfenil)-4,6,7-trimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida ó una sal del mismo.

2048
2083

17. N-(7-acetil-3-(4-isopropilfenil)-4,6-dimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida ó una sal del mismo.
18. N-(3-(4-isopropilfenil)-7-metoxi-4,6-dimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida ó una sal del mismo.
19. (+)-N-((3R)-7-acetil-3-(4-isopropilfenil)-4,6-dimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida ó una sal del mismo.
20. (+)-N-(tert-butil)-N'-((3R)-3-(4-isopropilfenil)-4,6,7-trimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)urea ó una sal del mismo.
21. N-(3-(4-isopropilfenil)-4,6-dimetil-7-fenil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida ó una sal del mismo.
22. N-(7-(3-dimetilaminofenil)-3-(4-isopropilfenil)-4,6-dimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida ó una sal del mismo.
23. N-(3-hidroxipropil)-N'-((3R)-3-(4-isopropilfenil)-4,6,7-trimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)urea ó una sal del mismo.
24. N-((4-isopropil-3-(2-metoxietoxi)-fenil)-4,6,7-trimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida ó una sal del mismo.
25. N-(7-(4-isopropilbencil)-3,4,6-trimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida ó una sal del mismo.
26. N-(3-(4-tert-butilfenil)-2,2,4,6,7-pentametil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida ó una sal del mismo.
27. N-(3-(4-isopropilfenil)-4,6,7-trimetil-3H-espiro(1-benzofuran-2,1'-ciclopentan)-5-il)-3,3-dimetilbutanamida ó una sal del mismo.
28. N-(3-(4-isopropilfenil)-4,6-dimetil-7-propil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida ó una sal del mismo.
29. (+)-N-((3R)-7-(1-hidroxietil)-3-(4-isopropilfenil)-4,6-dimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida ó una sal del mismo.

30. N-(7-(6-fluoropiridin-3-il)-3-(4-isopropilfenil)-4,6-dimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida ó una sal del mismo.

31. N-(7-(3-furil)-3-(4-isopropilfenil)-4,6-dimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida ó una sal del mismo.

32. N-(7-hidroxi-3-(4-isopropilfenil)-4,6-dimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida, o una sal del mismo.

33. N-(7-etoxi-3-(4-isopropilfenil)-4,6-dimetil-2,3-dihidro-1-benzofuran-5-il)-3,3-dimetilbutanamida ó una sal del mismo.

LMA\LMAND-165800WPC14658

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 10 - 7,951
FECHA : FEBRERO 1 DE 2010

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-129098-00007-0000

Reg. No. 2010-02-17-16-00000 - Dep. Miguel RODRIGUEZ
Cra. 14 - P.A. UNICUYU - Fve. 379 - LASLACIONAL
Apt. 424 - Ed. 5Pto. S. ARCEQUEL - Tel. 05-15

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	3289343	02/02/2010	77,170,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE ADMINISTRACION	
		99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	1,000.00
		TOTAL :	\$ 1,000.00

SON: NIL PESOS

RESPONSABLE

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER
SUSTITUIDA POR NINGUN RECIBO.

COLO: 14656-841-006-3

2052

2087

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 10 - 9.649
FECHA : FEBRERO 8 DE 2010

FOLIO RENTISTICO AL CREDITO Y COMERCIO



No. 05-129098-00007-0000

Fecha: 2010-02-17 16:09:58 Dep: 2010 DIR NOLEVASOR
Dir: 11 PATENTE DE LUGAR Dep: 179 FASE NACIONAL
Act: 444 RLS PULSTAR LUGAR Folios: 15

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	17-02-10	08/02/2010	37,065,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROYECTO I	21 CERTIFICACIONES	13,000.00
TOTAL :		13,000.00

SON: TRECE MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL ASUNTO No.

0010: 14656- 841- 006-3.

2053
2088

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 809176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 10 - 12,281
FECHA : FEBRERO 15 DE 2010

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 05-129098-00007-0000
Fecha: 2010/02/15 15:09:56 Dep: 2010 DIRECCION
DE PATENTAS Y MARCA REGISTRADA
ART 444 DEL SPOLSIATRIQUEL Folio 15

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PASO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	175529563	15/02/2010	40,410,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTIS\$ (COP)	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	30005-01-01	SOLICITUDES	
		114 PTC GAP-13 EXAMEN DE PATENTIBILIDAD	470,000.00
		TOTAL :	\$ 470,000.00

SON: CUATROCIENTOS SETENTA MIL PESOS

RESPONSABLE



RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

0010: 14656-841-0063

2054
2084

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

Bogotá, D.C., 19-mar-2010

Apoderado: Emilio Ferrero.

ASUNTO	Radicación	05-129098
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio	4336
	Folios	

Patente de Invención ☒

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

No. Sol. Internacional PCT/JP2004/009355
Fecha de Presentación Interna. 06/ene/2005

Como resultado del examen de fondo, realizado con fundamento nuevamente en el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

1. Documentos estudiados

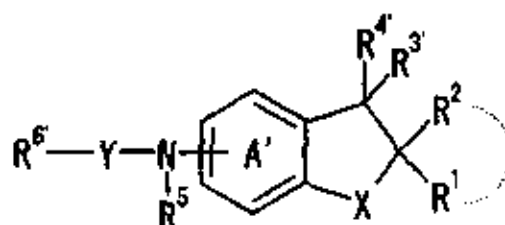
- | | | | |
|------|--------------------------|--|--|
| 1.1. | <u>Descripción:</u> | Folios: 664 a 1331
Folios 1389 a 1943 | Como se radicó inicialmente.
Modificaciones realizadas. |
| 1.2. | <u>Reivindicaciones:</u> | Folios 1332 a 1347
Folios 1366 a 1380
Folios 1944 a 1959
Folios 1960 a 1970
Folios 2044 a 2049 | Como se radicó inicialmente.
Modificaciones realizadas.
Nuevas modificaciones.
Nuevas modificaciones.
Nuevas modificaciones. |
| 1.3. | <u>Prioridad:</u> | Folio: 1, JP 2003-182039, 26-jun-2003. | |
| 1.4. | | | |

2. Modificaciones no aceptadas (artículo 34 D.486 de la C.A.N.)

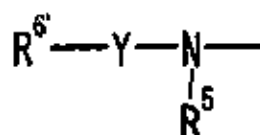
No se aceptan las modificaciones por que ha introducido materia en los significados de R⁶ (erre seis prima) y R⁴ (erre cuatro prima), de la fórmula (I') (uno prima), que ahora viene como reivindicación 1 en el nuevo capítulo reivindicatorio, que corresponde a la cuarta modificación del capítulo reivindicatorio folios 2044 a 2049, la reivindicación que comprende esa fórmula está en la reivindicación 13 del capítulo reivindicatorio original a saber:

2055
2090

(13) a compound represented by Formula (I')



wherein, X is an oxygen atom, an optionally substituted sulfur atom or an optionally substituted imino group, R¹ and R² are independently a hydrogen atom, an optionally substituted hydrocarbon group, an optionally substituted heterocyclic group, an optionally substituted hydroxyl group, an optionally substituted mercapto group or an optionally substituted amino group, or R¹ and R² may be taken with the adjacent carbon atom to form an optionally substituted ring, R³ is a hydrogen atom, an optionally substituted hydrocarbon group, an optionally substituted hydroxyl group, an optionally substituted mercapto group or an optionally substituted amino group, R⁴ is a hydrogen atom, an optionally substituted alkyl group, an optionally substituted aryl group, or an optionally substituted heterocyclic group, Y is -CO-, -SO-, or -SO₂-, R⁵ is a hydrogen atom or an optionally substituted hydrocarbon group, R⁶ is an optionally substituted hydrocarbon group (provided that both of R¹ and R² are not a hydrogen atom, R⁶ has no benzene ring), an optionally substituted hydroxyl group or an optionally substituted amino group, and ring A' is a benzene ring which may have further substituent in addition to a group represented by the following formula



wherein, each symbol has the same meaning as described above, or a salt thereof.

Para la fórmula (I'), no existe el sustituyente R⁶ (erre seis), existe el R^{6'} (erre seis prima) y jamás R^{6'} (erre seis prima) toma los significados de R⁶ (erre seis) de otras fórmulas, véase folios 32-33; 652-653, el sustento de la descripción folios 1396 último párrafo-1397 ó 1948-1949. Allí también aparece los sustituyentes R^{4'} (erre cuatro prima) que también le introducen materia, por lo el capítulo reivindicatorio modificado por cuarta vez, no es aceptado, introduce materia en contravención con los dispuesto en el artículo 34 D.486 de la C.A.N.

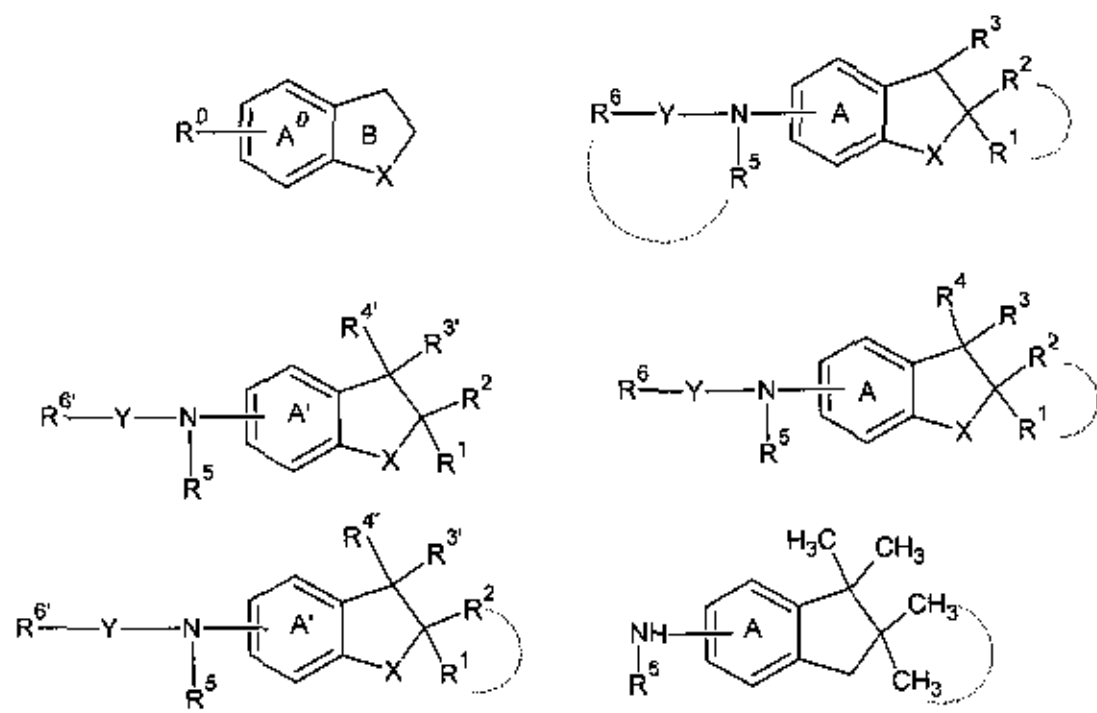
***Por lo tanto es necesario reiterar lo indicado en el examen de patentabilidad. Oficio N°11343 folios 1973-2035.**

1. Objeto de la invención

Título de la solicitud: MODULADOR DEL RECEPTOR CANABINOIDE

El objeto de la presente solicitud de patente de invención consiste en derivados de un modelismo molecular que incluyen compuestos derivados 2,3-dihidro-benzofuranaminas, derivados de 2,3-dihidro-5-benzotiofenaminas y derivados 3,4-dihidroquinolinamina de las fórmulas:

2086
2091



- Reivindicación 1: Compuestos de la fórmula (I₀);
- Reivindicaciones 2-12: Compuestos de la fórmula (I₀);
- Reivindicaciones 13-49: Compuestos de fórmula (I₁);
- Reivindicación 50: Un profármaco;
- Reivindicación 51: fármaco o profármaco de la reivindicación 13;
- Reivindicaciones 52-54: Uso de compuestos;
- Reivindicación 55: Método de tratamiento.

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de compuestos útiles para tratar inflamación, osteoartritis, artritis reumatoide, cáncer, repercusión ó isquemia en apoplejía ó ataque cardíaco, enfermedades inmunes.

Se catalogó la invención, según la Clasificación Internacional de Patentes (IPC.):A61K31/343, A61K31/357, A61K31/381.

2. De la solicitud de Patente (Art. 28 de la Decisión 486 o art. 22 del Tratado PCT)

a. Reivindicaciones (artículo 30 D 486 de la C.A.N.)

- La reivindicación 1 es indefinida, porque aparece un sustituyente R⁰ bajo la denominación genérica de "grupo acilamino opcionalmente sustituido" esos términos no delimitan perfectamente el alcance de la invención ya, que no son equivalentes técnicos de ninguna estructura química de manera inequívoca.
- Las reivindicaciones que reclaman materia con el término "profármaco", estos compuestos están reclamados por referencias o propiedades deseadas, a saber, su capacidad del que es metabolizado in vivo para obtener un compuesto definido mediante modelismo molecular en las reivindicaciones, sin proporcionar la información técnica de cuál es su estructura y cómo alcanzar esa meta.
- Las reivindicaciones 5-12, no son claras, se encabezan como "el modulador", es un sustantivo que reemplaza a compuesto y el resto del texto de la reivindicación se refiere a su actividad farmacológica y a las enfermedades a tratar, lo cual no son

2057
2097

características técnicas de compuesto.

- Las reivindicaciones 1-29 no son claras y concisas, ya que reclaman un número extremadamente grande de compuestos, mediante modelismo moleculares, muy amplios y especulativos obtenidos por extrapolación mediante computadoras, ya que el sustento técnico real, aparece sólo para una pequeña parte del total de los compuestos reclamados.

-Las reivindicaciones 50 y 51 reclaman "profarmaco", estos compuestos están reclamados por referencias o propiedades deseadas, a saber, su capacidad del que es metabolizado in vivo para obtener un compuesto definido mediante modelismo molecular en las reivindicaciones, sin proporcionar la información técnica de cuál es su estructura y cómo alcanzar esa meta.

El capítulo reivindicatorio estudiado [folios 1960-1970] 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.

-Excepción a la patentabilidad (artículo 20 D486 literal d) de la C.A.N.)

-Las reivindicación 55 reclama un método de tratamiento terapéutico; el objeto de esta reivindicación no puede ser patentable según el artículo 20 D486 literal d) de la C.A.N.

3. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso (artículos 14 y 21 D 486 de la C.A.N.)

Las reivindicaciones 52-54 reclaman el uso de compuestos y el artículo 14 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina "... Los Países Miembros otorgarán patentes para las invenciones sean de productos o procedimientos en todos los campos de la tecnología..."; aquí no se hace alusión al uso para otorgarle patente. Los usos o segundos usos no son patentables, de conformidad con la sentencia del TJAC 89-AI-2000, los usos en general no son patentables

4. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha que se ha tenido en cuenta para determinar el Estado de la Técnica es la fecha de presentación de la solicitud prioritaria 26-jun-2003.

Teniendo en cuenta la fecha indicada se realizó la búsqueda en el estado de la técnica de documentos relacionados con la materia reclamada como nueva e inventiva en la solicitud, encontrándose los siguientes documentos más relevantes:

- Relacionar los documentos encontrados dentro del cuadro

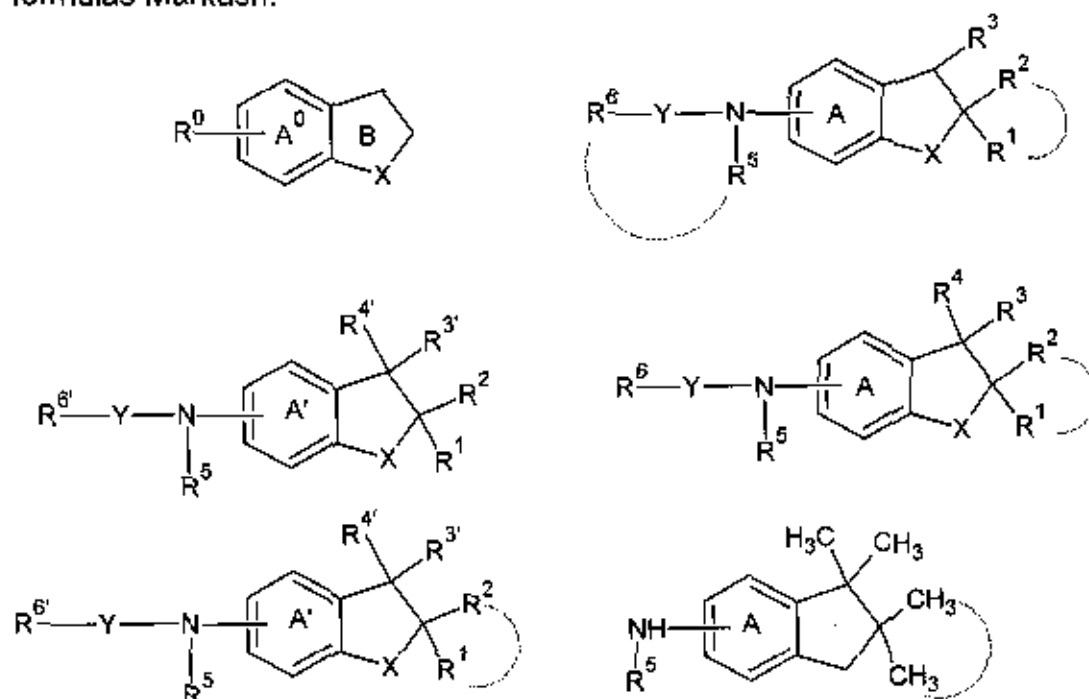
Nº	Documento	Título	Fecha de publicación*
----	-----------	--------	-----------------------

D1	EP0483772	Aminocumaran derivatives, their production and use	06-may-1992
D2	WO9529907	Benzofuran derivatives useful as inhibitors of bone resorption	09-nov-1995
D3	US5.496.853	Benzoxa condensed ring compounds, process for producing same and pharmaceutical composition comprising the same	05-mar-1996
D4	WO9607651	Dihydrobenzofuran and related compounds useful as anti-inflammatory agents	14-mar-1996
D5	WO9808842	Cyclic ether compounds as sodium channel modulators	5-mar-1998
D6	EP1136477	Benzofuran derivatives, process for the preparation of the same and uses thereof	15-jun-2000
D7	US 6.172.085	Cyclic ether compounds as sodium channel modulators	09-ene-2001
D8	EP 1323716	Promoters for the proliferation and differentiation of stem cells and/or neuron precursor cell	11-abr-2002

12. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486 de la C.A.N.)

12.1 Novedad (artículo 16 D486 de la C.A.N.)

La solicitud en estudio reclama los compuestos derivados de un modelismo molecular que reclama los compuestos que caen bajo el alcance de las siguientes fórmulas Markush:



-D1 enseña derivados aminocumaran que son reclamados como nuevos e inventivos en la presente solicitud, véase toda la anterioridad, especialmente pg.2-15,18,19.

2059
2094

--D2 enseña derivados amino-benzofurano que son reclamados como nuevos e inventivos en la presente solicitud, véase toda la anterioridad, especialmente pg. 2-9 y ejemplos.

-D3 enseña derivados Benzofurano que son reclamados como nuevos e inventivos en la presente solicitud, véase toda la anterioridad, especialmente columnas 9,10, 13-16, 27-30.

-D4 enseña derivados dihydrobenzofuran que son reclamados como nuevos e inventivos en la presente solicitud, véase toda la anterioridad, especialmente pgs. 1-6, 9,12,15,16.

-D5 enseña derivados aminobenzofurano que son reclamados como nuevos e inventivos en la presente solicitud, véase toda la anterioridad, especialmente pg.2-15,52,73,89,90, tablas 1-5, pg.167.

-D6 enseña derivados aminobenzofuran que son reclamados como nuevos e inventivos en la presente solicitud, véase toda la anterioridad, especialmente pg.7-17, tablas 1-2

-D7 enseña derivados aminobenzofurano que son reclamados como nuevos e inventivos en la presente solicitud, véase toda la anterioridad, especialmente columnas 21, 22,37,38, 63,64.

-D8 enseña derivados aminobenzofurano que son reclamados como nuevos e inventivos en la presente solicitud, véase toda la anterioridad, especialmente pg. 4-15,18,19.

Tal como puede verse el capítulo reivindicatorio no cumple con el requisito del artículo 16 D486 de la C.A.N.

13. Conclusión:

Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

*La solicitud que no cumple con el requisito de novedad, obviamente tampoco cumple con el requisito de nivel inventivo.

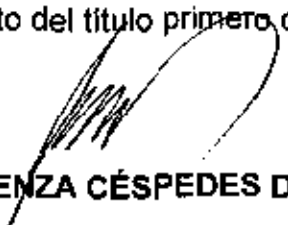
Documento N°	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	1-55	Novedad y nivel inventivo
D2	1-55	Novedad y nivel inventivo
D3	1-55	Novedad y nivel inventivo
D4	1-55	Novedad y nivel inventivo
D5	1-55	Novedad y nivel inventivo

2060
2095

D6	1-55	Novedad y nivel inventivo
D7	1-55	Novedad y nivel inventivo
D8	1-55	Novedad y 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 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.

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
26 MAR. 2010

CONCEPTO TÉCNICO No. 1207 | **EXAMINADOR TÉCNICO Código No. 202012**