OLARTERAISBECK
OLARTE RAISBECK MOURE & CASTRO LTDA.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 06-002051- -00005-0000
Fecha: 2009-08-04 15:47:13 Dep: 2020 NUECREACIONI
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 9

Señores
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES
E. S. D.

Re: Expediente No. 06-002.051
Solicitud de patente de invención titulada: "DERIVADOS DE QUINOLINA Y QUINAZOLINA QUE TIENEN AFINIDAD HACIA RECEPTORES DE TIPO 5HT1"
Solicitante: GLAXO GROUP LIMITED.
Nuestra Ref.: P2006/000003

RESPUESTA AL OFICIO No.5196 NOTIFICADO POR FIJACIÓN EN LISTA No. 131, DE FECHA 8 DE MAYO DE 2009
(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, como consta en la sustitución de poder adjunta, me permito manifestar lo siguiente ante el auto emanado por ese Despacho, dentro del plazo legal de previsto en el artículo 45 de la Decisión 486, en los siguientes términos:

1. En primer lugar y con el ánimo de brindar mayor claridad a la materia reivindicada, me permito presentar un **Capítulo Reivindicatorio Modificado**, que reemplaza en su totalidad al Capítulo Reivindicatorio presentado al momento de radicar esta solicitud.

Así entonces, el Capítulo Reivindicatorio Modificado contiene los siguientes cambios:



Reivindicación original	Modificaciones
7 y 11 a 18	Eliminadas.
----	Nueva Reivindicación 1, se limita el significado de R^3 y R^4. Encuentra soporte en la página 11 de la Descripción.
6, 8, 10, 19 y 20	Nuevas Reivindicaciones 2-6.

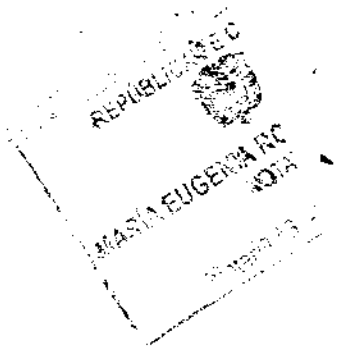
Valga anotar que las modificaciones efectuadas al Capítulo Reivindicatorio cumplen a cabalidad con lo estipulado en el Artículo 34 de la Decisión 486, ya que éstas de ninguna manera implican una ampliación de la protección correspondiente a la divulgación contenida en la solicitud inicial.

2. a- El Examinador argumenta que la Reivindicación 1 es excesivamente amplia y reclama un número ilimitado de compuestos. Adicionalmente, el Examinador señala que algunos términos tales como "arilo" y "cuando R^3 y R^4 son tomados juntos", son demasiado amplios. De manera similar, el Examinador argumenta que la expresión "tal como" es indefinida y da lugar a un mayor número de sustituyentes que aquellos indicados en la reivindicación.

b- i) En primer lugar, debo subrayar que el Manual Andino de Patentes (MAP) establece que la Descripción debe estar escrita en el lenguaje propio del campo técnico de la invención. Adicionalmente el MAP menciona que "el propósito de la Descripción es garantizar que la solicitud contiene la información suficiente para que una persona versada en el arte pueda eventualmente reproducir la invención".[1]

En el presente caso, los términos "arilo", y "cuando R^3 y R^4 son tomados juntos" son perfectamente entendibles por cualquier persona medianamente versada en el campo químico. Por lo tanto, y cumpliendo a cabalidad con las disposiciones del Manual Andino de Patentes, toda persona con experiencia elemental en química orgánica entendería que estos términos tienen el propósito de ilustrar las características de la invención y no de abarcar materia más allá de la definida.

Adicionalmente, la presente invención incluye numerosos ejemplos (**170 ejemplos**) en los que se ilustra y se da soporte para gran variedad de sustituyentes y modalidades de los compuestos de interés.


REPÚBLICA DEL
MARÍA EUGENIA RIC
NOTA

Así mismo la Descripción contiene definiciones completas que ilustran el alcance de los términos incluidos en las reivindicaciones, ejemplificando igualmente muchos de los significados preferidos para dichos términos (páginas 2 a 4 de la Descripción).

Finalmente, vale la pena anotar que el uso de estos términos y otros análogos que indican la posibilidad de obtener la invención en diversas modalidades que cubren la totalidad del concepto inventivo desarrollado, es una práctica aceptada a nivel mundial en el ámbito de las patentes, e incluso la misma SIC ha conferido el privilegio de patentes para invenciones que incluyen dichos términos.

ii) En cuanto a la expresión "tal como", me permito señalar que la Reivindicación 7 que la comprendía, ha sido eliminadas del Capitulo Reivindicatorio Modificado.

iii) Por otra parte, y en relación con la amplitud de la Reivindicación 1, me permito subrayar que con el propósito de facilitar el trámite de la presente solicitud, y sin que esto signifique una aceptación a los argumentos del Examinador, la nueva Reivindicación 1 ha sido limitada drásticamente. Específicamente, la definición para IIa y IIb en R^3 y R^4 fue restringida a la modalidad de la página 5, línea 16 a la página 6, línea 15.

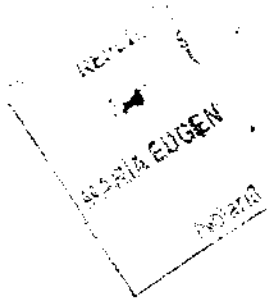
3. a- El Examinador establece que el proceso de la Reivindicación 11 es inconciso puesto que no define las condiciones de conversión ni los productos finales. Igualmente, el Examinador señala que la Formula VII no es clara.

b- Considero superada la anterior objeción, en tanto que la Reivindicación 11 ha sido eliminada del Capitulo Reivindicatorio Modificado.

4. a- El Examinador señala que las Reivindicaciones 12-18 no son patentables porque reclaman usos y métodos de tratamiento.

b- Considero superada la anterior objeción en tanto que las Reivindicaciones 12-18 han sido eliminadas del Capitulo Reivindicatorio Modificado.

5. a- El Examinador indica que la Descripción divulga un pKi mayor a 6.0 pero



b- En respuesta, me permito señalar que todos los compuestos que se encuentran dentro del alcance de la nueva Reivindicación 1 han sido evaluados en el ensayo de 5-HT1A en las páginas 24-25 de la Descripción. Específicamente, los Ejemplos 1-39, 43-61, 63-88, 93, 88, 101, 103, 106-110, 121, 130, 141, 142, 145-153, 156-163, 167, 168 y 170 evaluados, presentan actividades biológicas superiores a 6.0. De estos ejemplos, los Ejemplos 1-76, 78-96, 98-102, 104-127, 129-135, 137-154, y 156-170 presentan actividades biológicas superiores a 7.0. Los Ejemplos 1-17, 19-51, 53, 55-60, 62, 64-76, 79-90, 92-96, 98, 101, 104-108, 110-117, 119-127, 130-135, 137-146, 148-154, 156-165 y 167-170 presentan actividades biológicas superiores a 8.0.

5. Por todo lo anterior, considero que las objeciones presentadas por el Examinador en su examen de fondo No. 983 han sido resueltas y por consiguiente solicito respetuosamente que el Despacho emita un segundo examen de fondo donde se pronuncie sobre los requisitos de patentabilidad, en particular respecto de la novedad y el nivel inventivo. De lo contrario, ruego se tengan por cumplidos tales requisitos, en tanto no se logró desvirtuar ninguno de ellos por parte del Despacho, 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
 Sustitución de poder

EL ANTERIOR ESCRITO DIRIGIDO A
Super Intendencia de Indus y Comer
Carlos R. Olarte 79782747 74295 D/C de la
14 AGO 2009
RAMA JUDICIAL DE COLOMBIA
OFICINA BOJAS DE URUETA

OLARTERAISBECK
OLARTE RAISBECK MOURE & CASTRO LTDA.

Señores
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
E. S. D.

Re: **Expediente No. 06-002.051**
Solicitud de patente de invención titulada: "DERIVADOS DE QUINOLINA Y QUINAZOLINA QUE TIENEN AFINIDAD HACIA RECEPTORES DE TIPO 5HT1"
Solicitante: GLAXO GROUP LIMITED.
Nuestra Ref.: P2006/000003

SUSTITUCIÓN DE PODER

J. IAN RAISBECK LLINAS, mayor de edad y vecino de Bogotá D.C., identificado como aparece al pie de mi firma, en mi carácter de apoderado de la sociedad de la referencia, respetuosamente me permito manifestar que **SUSTITUYO** el poder a mi conferido por la mencionada sociedad, en el doctor **CARLOS R. OLARTE**, mayor de edad, domiciliado en Bogotá D.C., identificado con la Cédula de Ciudadanía No. 79.782.747 de Bogotá, y portador de Tarjeta Profesional de Abogado No. 74.295 expedida por el Consejo Superior de la Judicatura, para que sea el quien en adelante asuma el trámite de la presente acción.

El apoderado sustituto conserva las mismas facultades del principal.

Atentamente,

J. IAN RAISBECK
C.C. No. 79.376.996 de Bogotá
T.P. 135.799 del C. S. de la J.

Super Intendencia de Industria y Comercio.

N. Jan Borisbeck
79376996 - 735799 d.c. d. 16 V

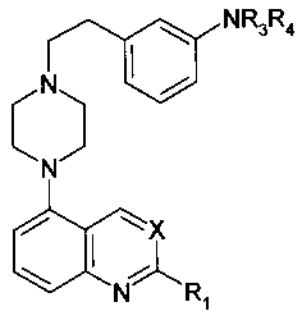
4 AGO 2006

REPÚBLICA DE COLOMBIA

MARÍA EUGENIA ROJAS DE URUETA
NOTARIA

CAPITULO REIVINDICATORIO MODIFICADO
(PRIMER EXAMEN DE FONDO)

1. Un compuesto de fórmula (Ib) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo:



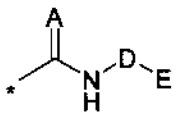
(Ib)

donde:

R_1 es halógeno, ciano, alquiloC_{1-6}, alcoxiC_{1-6}, haloalcoxiC_{1-6} o haloalquilo C_{1-6};

X es N ó CH

R_3 y R_4 son independientemente hidrógeno, alquilo C_{1-6}, alquil C_{1-6} sulfonilo o un grupo que tiene la fórmula (IIa):



(IIa)

donde

A es oxígeno o azufre;

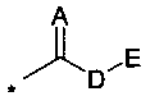
D es $-(CH_2)_t-$, $-(CH_2)_tO-$ o $-O(CH_2)_t-$;

t es 0, 1, 2, 3, 4; y

E es alquilo C_{1-6}, cicloalquilo C_{3-7} (opcionalmente sustituido por uno o más sustituyentes independientemente seleccionados entre halógeno, hidroxi, oxo, alquiloC_{1-6}, ciano, CF_3, OCF_3, alcoxiC_{1-6} y alcanoilo C_{1-6}), o arilo (opcionalmente

sustituido por uno o más sustituyentes independientemente seleccionados entre halógeno, alquiloC_{1-6}, CF_3, ciano, hidroxi, alcanoiloC_{1-6} y alcoxiC_{1-6}); o

un grupo que tiene la fórmula (IIB)



(IIb)

donde

A es oxígeno o azufre;

D es $-(CH_2)_t-$, $-(CH_2)_tO-$ o $-O(CH_2)_t-$;

t es 0, 1, 2, 3, 4; y

E es alquilo C_{1-6}, cicloalquilo C_{3-7} (opcionalmente sustituido por uno o más sustituyentes independientemente seleccionados entre halógeno, hidroxi, oxo, alquiloC_{1-6}, ciano, CF_3, OCF_3, alcoxiC_{1-6} y alcanoilo C_{1-6}), o arilo (opcionalmente sustituido por uno o más sustituyentes independientemente seleccionados entre halógeno, alquiloC_{1-6}, CF_3, ciano, hidroxi, alcanoiloC_{1-6} y alcoxiC_{1-6});

o R_3 y R_4, junto con el átomo de nitrógeno al que están acoplados R_3 y R_4, forman un grupo heterocíclico de 3–7 miembros monocíclico o un grupo heterocíclico de 8–11 miembros bicíclico, en el que cada grupo está opcionalmente sustituido por uno o más sustituyentes seleccionados entre halógeno, oxo, alquiloC_{1-6}, ciano, CF_3, alcoxiC_{1-6}, alcanoiloC_{1-6}, arilo y arilalquiloC_{1-6} (en el que el arilo y el arilalquiloC_{1-6} están además opcionalmente sustituidos por uno o más de halógeno, oxo, alquiloC_{1-6}, ciano, CF_3, alcoxiC_{1-6} o alcanoiloC_{1-6}).

2. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, donde E es un anillo de 5-7 miembros aromático monocìclico donde uno o más de los átomos de carbono en el anillo es opcionalmente reemplazado por un heteroátomo independientemente seleccionado entre nitrógeno, oxígeno y azufre, en el que el anillo está opcionalmente sustituido por uno o más sustituyentes independientemente seleccionados entre oxo, halógeno, alquiloC_{1-6}, , CF_3, ciano, hidroxi, alcanoilo C_{1-6} y alcoxiC_{1-6}.

3. Un compuesto de acuerdo a las Reivindicaciones 1 y 2, donde en el que R_3 y R_4, junto con el átomo de nitrógeno al que están acoplados R_3 y R_4, forman un grupo heterocíclico de 4–6 miembros monocíclico opcionalmente sustituido por uno o más sustituyentes seleccionados entre oxo, halógeno, alquilo C_{1-6}, ciano, CF_3, alcoxiC_{1-6}, alcanoiloC_{1-6}, arilo y arilalquiloC_{1-6} (en el que el arilo y el arilalquiloC_{1-6} son además opcionalmente sustituidos por uno o más de halógeno, oxo, alquiloC_{1-6}, ciano, CF_3, alcoxiC_{1-6} o alcanoiloC_{1-6}); o R_3 y R_4, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos R_2 y R_3, forman un grupo heterocíclico de 8–10 miembros bicíclico opcionalmente sustituido por uno o más sustituyentes seleccionados entre oxo, halógeno, alquiloC_{1-6}, ciano, CF_3, alcoxiC_{1-6}, alcanoiloC_{1-6}, arilo y arilalquiloC_{1-6} (en el que el arilo y el arilalquiloC_{1-6} son además opcionalmente sustituidos por uno o más de halógeno, oxo, alquiloC_{1-6}, ciano, CF_3, alcoxiC_{1-6} o alcanoiloC_{1-6}).

4. Un compuesto de acuerdo a la Reivindicación 1, que es:

3-(3-{2-[4-(2-metil-5-quinolinil)-1-piperazinil]etil}fenil)-1,3-oxazolidin-2-ona;

N-(3-{2-[4-(2-metil-5-quinolinil)-1-piperazinil]etil}fenil)-*N'*-fenilurea;

N-[2-(metiloxi)fenil]-*N'*-(3-{2-[4-(2-metil-5-quinolinil)-1-piperazinil]etil}fenil)urea;

1-(3-{2-[4-(2-metil-5-quinolinil)-1-piperazinil]etil}fenil)-2-imidazilidinona;

2,4-dimetil-*N*-(3-{2-[4-(2-metil-5-quinolinil)-1-piperazinil]etil}fenil)-1,3-tiazol-5-carboxamida;

N-(3-{1-hidroxi-2-[4-(2-metil-5-quinolinil)-1-piperazinil]etil}fenil)-2,4-dimetil-1,3-tiazol-5-carboxamida;

2-fluoro-*N*-(3-{2-[4-(2-metil-5-quinolinil)-1-piperazinil]etil}fenil)benzamida;

3-(3-{2-[4-(2-metil-5-quinolinil)-1-piperazinil]propyl}fenil)-1,3-oxazolidin-2-ona;

3-(3-{2-[(2R)-2-metil-4-(2-metil-5-quinolinil)-1-piperazinil]etil}fenil)-1,3-oxazolidin-2-ona;

1-metil-3-(3-{2-[4-(2-metil-5-quinolinil)-1-piperazinil]etil}fenil)-2-imidazolidinona;

1-(4-fluoro-3-{2-[4-(2-metil-5-quinolinil)-1-piperazinil]etil}fenil)-2-imidazolidinona;

3-(4-fluoro-3-{2-[4-(2-metil-5-quinolinil)-1-piperazinil]etil}fenil)-1,3-oxazolidin-2-ona;

1-(3-{2-[4-(2-metil-5-quinolinil)-1-piperazinil]etil}fenil)-2,4-imidazolidindiona;

1-(3-{2-[4-(2-metil-5-quinolinil)-1-piperazinil]etil}fenil)-1,3-dihidro-2H-imidazol-2-ona;

1-metil-3-(3-{2-[4-(2-metil-5-quinolinil)-1-piperazinil]etil}fenil)-1,3-dihidro-2H-imidazol-2-ona;

4,4-dimetil-1-(3-{2-[4-(2-metil-5-quinolinil)-1-piperazinil]etil}fenil)-2-imidazolidinona;

o una sal farmacéuticamente estable de los mismos.

5. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de acuerdo a cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 4y un vehículo o excipiente farmacéuticamente aceptable

6. Un procedimiento para la preparación de una composición farmacéutica como se definió en la Reivindicación 5, que comprende: mezclar un compuesto de acuerdo a cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 4 y un vehículo o excipiente farmacéuticamente aceptable.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
J. IAN RAISBECK

ASUNTO	Radicación	06-2051
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio	[illegible]
	Folios	3

Patente de Invención [X] Patente de Modelo de Utilidad []

Vía Nacional []

Vía PCT (fase nacional) [X] Cap. I [] Cap. II [X]

No. Sol. Internacional PCT/EP2004/008000
Fecha de Presentación Internal. 15-07-2004

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

Descripción:	Folios: 131 a 253	(como se radicó inicialmente)
Reivindicaciones:	Folios 254 a 263	(como se radicó inicialmente)
	Folios	(modificación)
Prioridad:	Folio: 1	
	Fecha: 18-07-2003; país y número: 0316915.8	

2. Objeto de la Invención

Titulo de la invención: "DERIVADOS DE QUINOLINA Y QUINAZOLINA QUE TIENEN AFINIDAD HACIA RECEPTORES DE TIPO 5HT1"

Problema Técnico Planteado: La necesidad de compuestos que posean afinidad hacia receptores del tipo 5-HT_1, útiles para el tratamiento de enfermedades del SNC.

3. De la solicitud de Patente

a. Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

Los términos "arilo" y "heterociclilo" le restan concisión a la solicitud por cuanto describen un elevado número de compuestos posibles los cuales no se delimitan dentro de la descripción. Arilo corresponde a cualquier anillo de tipo aromático que puede estar conformado por uno o mas anillos fusionados y que puede contener uno o más heteroátomos en diferentes posiciones dando lugar a compuestos química y funcionalmente diferentes entre si, como fenil, naftaleno, antraceno, pirrolilo, indolilo, tetrahidrobenzofuranilo etc. Igualmente al utilizar el término heterocíclico no se especifica la cantidad tipo y posiciones de los heteroátomos y si estos anillos están saturados o poliinsaturados. El solicitante debe limitar su reclamación a aquellos compuestos que se encuentren soportados en la descripción y sobre los que exista información que soporte su utilidad para solucionar el problema técnico planteado.

La reivindicación 1 carece de concisión debido al elevado número de sustituyentes posibles para los radicales R3 y R4 especialmente en el sustituyente "E", los cuales presentas marcadas diferencias estructurales entre si ya que van desde cadena alifáticas hasta anillos aromáticos sustituidos. El solicitante debe limitar su reclamación a aquellos compuestos que se encuentren enteramente soportados en la descripción y que sean una solución al problema técnico planteado. En los ejemplos preferidos por esta solicitud el anillo fenil esta sustituido por:

- Oxazolidin-2-ona
- N-fenilurea
- Urea sustituida
- Imidazilidinona
- Tiazol-5-carboxamida
- Benzamida

Las reivindicaciones mencionadas no cumplen con el requisito de concisión 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 de 6 reivindicaciones (folios 296 a 299). Luego del estudio de este documento, esta oficina establece que el mismo no es una ampliación de la materia contenida en la solicitud original y por lo tanto es aceptado para el estudio de Patentabilidad.

El solicitante argumenta que el término "arilo" es perfectamente entendible por cualquier persona medianamente versada en el campo químico. Por lo tanto toda persona con experiencia elemental en química orgánica entendería que estos términos tienen el propósito de ilustrar las características de la invención y no de abarcar materia más allá de la definida.

Esta oficina remite al solicitante al artículo 30 de la Decisión 486 en donde se establece que las reivindicaciones deben ser claras y concisas y estar enteramente sustentadas por la descripción. Los términos "arilo" y "heterocíclico" de la reivindicación 1 carecen de concisión puesto que cualquier persona con

302

ejemplos de homocíclicos y entre los heterocíclicos podemos tener incluso anillos fusionados de dos o mas ciclos con heteroátomos como N, O ó S, entre los que se encuentran el pirrolilo, tienilo, furilo, indolilo, quinoxalinilo, etc., los cuales son mencionados por el solicitante en la descripción en la página 3 (folio 133). Así, existe un elevado número de compuestos que presentan propiedades aromáticas y por lo tanto se encuentran agrupados en el término "arilo", por lo que la reivindicación 1 carece de concisión.

Igualmente, el término heterociclico representa un elevado número de compuestos ya que esta expresión se refiere a anillos que contienen uno o más heteroátomos, en donde el número, tipo y distribución de los heteroátomos puede variar; igualmente esta expresión abarca biciclos, saturados e insaturados, lo que comprende una gran cantidad de materia con propiedades fisicoquímicas diferentes. No es posible a partir de la información de actividad proporcionada por el solicitante en el folio 157 (pág 27) de la descripción, establecer si a pesar de tales diferencias estructurales contenidas en dichos sustituyentes los compuestos reclamados continúan siendo una solución al problema técnico. En conclusión para el técnico medio en la materia es claro que las expresiones arilo y heterocíclico abarcan una amplia cantidad de materia y por lo tanto la reivindicación 1 carece de concisión.

El solicitante argumenta que la descripción contiene definiciones completas que ilustran el alcance de los términos incluidos en las reivindicaciones, ejemplificando igualmente muchos de los significados preferidos para dichos términos.

Esta oficina se permite aclararle de manera respetuosa al solicitante, que las reivindicaciones deben ser claras y concisas por si mismas para que se pueda determinar sin ambigüedad hasta donde llegan los derechos del titular de la patente sin necesidad de remitirse al capítulo descriptivo.

En cumplimiento del articulo 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	EXAMINADOR TÉCNICO