

OLARTEMOURE

OLARTE MOURE & ASOCIADOS LTDA.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-033251- -00005-0000

Fecha: 2011-04-18 16:26:26 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 523 RESPUESTA Folios: 6

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

Re: Expediente No. 06-033.251

Solicitud de patente de invención titulada: "DERIVADOS DE 3-PROPIONITRILO-8-AZABICICLO[3.2.1]OCTANO, ACTIVOS COMO ANTAGONISTAS DEL RECEPTOR ACETILCOLINA MUSCARÍNICO".

Solicitante: GLAXO GROUP LIMITED

Nuestra Ref.: P2006/000060

RESPUESTA AL OFICIO No. 0954, NOTIFICADO POR FIJACIÓN EN LISTA No. 16,
DE FECHA 21 DE ENERO DE 2011
(PRIMER 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, en los siguientes términos:

1. En primer lugar, 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 en el momento de radicar la presente solicitud.

Así, el Capítulo Reivindicatorio modificado contiene los siguientes cambios:

- la Estructura II en la Reivindicación 1 ahora corresponde al compuesto del Ejemplo 2, y la Estructura I representa sus sales cuaternarias;
- la Reivindicación 2 corresponde a la Reivindicación 2 original que incorpora las limitaciones de la Reivindicación 1;

OLARTEMOURE

OLARTE MOURE & ASOCIADOS LTDA.

7

- la Reivindicación 3 específicamente reclama la Estructura II e incorpora las limitaciones de la Reivindicación 1;
- la definición de R¹ en la Reivindicación 4 encuentra soporte en la página 3, líneas 14 a 17 del Capítulo Descriptivo;
- la Reivindicación 5 especifica el compuesto del Ejemplo 2;
- la Reivindicación 6 especifica el compuesto del Ejemplo 7;
- la Reivindicación 7 especifica el compuesto del Ejemplo 6;
- la Reivindicación 8 corresponde a la formulación original de la antigua Reivindicación 5;
- las Reivindicaciones 9 y 10 reclaman formulaciones adicionales dirigidas a los compuestos específicos de las Reivindicaciones 6 y 7;
- las Reivindicaciones 11 y 12 especifican las formas farmacéuticas de las composiciones de la invención.

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, por el contrario, éstas corresponden a una drástica limitación del materia reivindicada.

2. a- El Examinador requiere que el título de la solicitud se ajuste según los compuestos que son objeto de la invención.

b- Con el ánimo de facilitar el trámite de la presente invención y atendiendo a la observación del Examinador, modifiqué el título de la presente solicitud de la siguiente manera:

DERIVADOS DE 3-PROPIONITRILO-8-AZABICICLO[3.2.1]OCTANO, ACTIVOS COMO
ANTAGONISTAS DEL RECEPTOR ACETILCOLINA MUSCARÍNICO.

3. a- El Examinador argumenta que las Reivindicaciones 6 a 13 reclaman materia no patentable.

b- Considero superada la anterior objeción, en tanto que las Reivindicaciones 6-13 fueron eliminadas del Capítulo Reivindicatorio Modificado.

4. a- El Examinador argumenta que las reivindicaciones no son concisas, en tanto que contienen términos generales e indefinidos como arilo y heteroarilo, y múltiples posibilidades de sustitución en los radicales R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y R⁷.

OLARTEMOURE

OLARTE MOURE & ASOCIADOS LTDA.

Adicionalmente, el Examinador argumenta que la patente US2800481 (D1) afecta el nivel inventivo de la presente invención.

El Examinador anota que D1 revela alcoholes terciarios derivados de 8-alkil-tropanos y sus sales de amonio cuaternarias (Columna 12, línea 64, Ejemplo 12, a la Columna 13, línea 42). El Examinador concluye que las diferencias estructurales entre los compuestos de la presente invención y los compuestos de D1, no proporcionan ventaja alguna o resultados inesperados, ya que no se evidencia actividad antimuscarínica incrementada.

El Examinador también argumenta que los compuestos de las Reivindicaciones 3 y 4, con sustituyentes diferentes a los de D1 en la posición 3 del azabicyclo[3.2.1]octano, como $R^4=CN$, $CONR^7R^8$, CO_2R^7 , $CH_2NR^8CONHR^7$, $CH_2NR^8CONR^6$, $CH_2NR^7CO_2R^5$, no son obvios a la luz de las enseñanzas de dicho arte previo.

b- i) En primer lugar, llamo respetuosamente la atención del Examinar sobre el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto, que se ha limitado exclusivamente a los compuestos de los Ejemplos 2, 7 and 6.

ii) En relación con D1, es importante destacar que este documento solamente enseña derivados de 3-alcohol-8-alkil-tropano, mientras que la presente invención no considera incluir alcoholes como sustituyentes de la posición 3 del núcleo 8-metil-8-azabicyclo[3.2.1]octano. Es más, D1 no proporciona enseñanza alguna que conduzca a la persona medianamente versada en la materia a incluir un grupo propionitrilo como sustituyente de tal posición, de hecho, los compuestos de D1 ni siquiera brindan la posibilidad de incluir un grupo CN en el carbono 2 de la cadena de alquilo que sustituye la posición 3 del ciclo del núcleo.

Adicionalmente, nada en D1 sugiere que compuestos con un grupo propionitrilo en la posición 3 del núcleo 8-metil-8-azabicyclo[3.2.1]octano serían activos como inhibidores de M_3 mAChR.

iii) Agradezco la opinión favorable del Examinador sobre el nivel inventivo de los compuestos de las antiguas Reivindicaciones 3 y 4, en particular en el caso que R^4 es CN, tal como se limitó en el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto. Por lo tanto, tal como lo manifestó el Examinador, doy por entendido que a la luz de D1, las modificaciones estructurales necesarias para obtener los compuestos de la presente invención no eran obvias para una persona medianamente versada en la materia, ni brinda una expectativa realista de lograr un efecto antimuscarínico.

OLARTEMOURE

OLARTE MOURE & ASOCIADOS LTDA.

5. Por todo lo anterior, considero que las objeciones presentadas por el Examinador en su examen de fondo No. 73 han sido resueltas y por consiguiente solicito respetuosamente que el Despacho tenga por cumplidos los requisitos de patentabilidad, 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

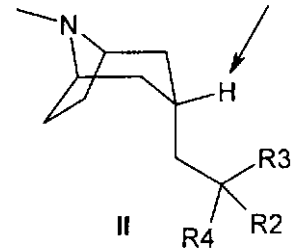
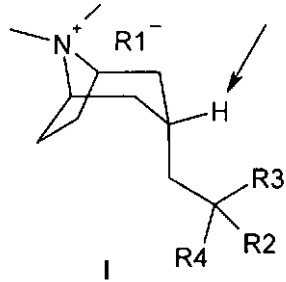
Anexos:

- Capítulo Reivindicatorio Modificado

CAPÍTULO REIVINDICATORIO MODIFICADO

Primer Examen de Fondo

1. Un compuesto que tiene la estructura I o II que se indican a continuación,



en las cuales:

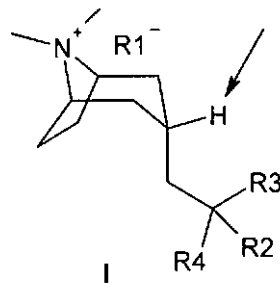
el átomo de H indicado está en la posición exo;

R1⁻ representa un anión asociado con la carga positiva del átomo de N;

R2 y R3 cada uno representa fenilo;

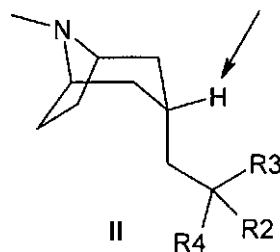
R4 representa CN.

2. Un compuesto según la reivindicación 1, que tiene la estructura I siguiente:



donde R1⁻, R2, R3 y R4 son como se define en la Reivindicación 1.

3. Un compuesto según la reivindicación 1, que tiene la estructura II siguiente:



donde R2, R3 y R4 son como se define en la Reivindicación 1.

4. Un compuesto según las Reivindicaciones 1 o 2, donde R1⁺ se selecciona de bromuro, yoduro, sulfato, benceno sulfonato y tolueno sulfonato.
- 5 5. Un compuesto que es el 3-((endo)-8-metil-8-aza-biciclo[3.2.1]oct-3-il)-2,2-difenil-propionitrilo.
6. Un compuesto que es el yoduro de (endo)-3-(2-ciano-2,2-difenil-etil)-8,8-dimetil-8-azonia-biciclo[3.2.1]octano.
- 10 7. Un compuesto que es el bromuro de (endo)-3-(2-ciano-2,2-difenil-etil)-8,8-dimetil-8-azonia-biciclo[3.2.1]octano.
8. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto según cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 7 y un vehículo farmacéuticamente aceptable.
- 15 9. Una composición farmacéutica que comprende yoduro de (endo)-3-(2-ciano-2,2-difenil-etil)-8,8-dimetil-8-azonia-biciclo[3.2.1]octano.
10. Una composición farmacéutica que comprende bromuro de (endo)-3-(2-ciano-2,2-difenil-etil)-8,8-dimetil-8-azonia-biciclo[3.2.1]octano.
- 20 11. Una composición farmacéutica según cualquiera de las Reivindicaciones 8 a 10 para administración por inhalación vía la boca o la nariz.
- 25 12. Una composición farmacéutica según cualquiera de las Reivindicaciones 8 a 11 para la administración por medio de un dispensador de medicamentos seleccionado de un inhalador de reservorio de polvo seco, un inhalador multidosis de polvo seco o un inhalador de dosis medidas.

30
