

CASTELLANOS & CO.
ABOGADOS
Calle 94 A No. 7 A-09
Bogotá, D.C. - COLOMBIA

151
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-074367-00005-0000

Fecha: 2010-05-19 14:21:45 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Fra 11 PATENTEIYII Eve: 379 I-ASENACIONALII
Act 444 RESPUESTAREQUE Folios: 9

Señora

Jefe de la División de Nuevas Creaciones

Superintendencia de Industria y Comercio

Ministerio de Comercio, Desarrollo Industria y Turismo

E. S. D.

Ref.: Expediente No. 06.074.367

Solicitud de Patente PCT entrada fase nacional para: **DERIVADOS DE INDAZOL**

Solicitante: **SANOFI-AVENTIS DEUTSCHLAND GMBH**

RESPUESTA A EXAMEN DE FONDO

LUIS PATIÑO LEIVA, mayor de edad, identificado y domiciliado como aparece al pie de mi firma, en atención a su oficio No. 2211 notificado el 19 de febrero de 2010, atentamente me permito dar repuesta al mismo de la siguiente manera:

Claridad de la solicitud

Presento nuevo como título **DERIVADOS DE INDAZOL**, el cual no hace referencia a los usos de los compuestos reivindicados y únicamente incluye la materia reivindicada.

Adicionalmente, presento un nuevo pliego reivindicatorio el cual supera las objeciones por falta de claridad y concisión. Las modificaciones introducidas son:

- La variable Y se limitó a -O-.
- Las variables R2 y R3 se usaron en el primer pliego reivindicatorio de dos formas: como sustituyentes de N en las fórmulas I y II y, como sustituyentes de la variable R. Con el objeto de discriminar esta dos formas de uso, se introdujeron en las nuevas reivindicaciones las variables R2' y R3' para definir los sustituyentes de la variable R.

- Con respecto a la variable R2, se eliminaron los significados H, alquilo (C₁-C₆) y arilo (C₆-C₁₀).
- Las variables R2 y R3 pueden formar junto con el átomo de nitrógeno que los porta un sistema de anillo monocíclico o bicíclico. La variante del sistema de anillo monocíclico formada por NR2R3 se ha limitado de manera análoga a la antigua reivindicación 4.
- Las condiciones a) y b) se eliminaron.
- La anterior reivindicación 2 se eliminó.
- Las anteriores reivindicaciones 3 a 9 se adaptaron de conformidad con la nueva reivindicación 1 y se renumeraron.
- Se eliminaron las reivindicaciones 11 a 13 y 14 a 21. Superando también la objeción por usos.

Mediante las modificaciones realizadas al capítulo reivindicatorio se han subsanado las objeciones planteadas por su Despacho de forma tal que las reivindicaciones cumplen con el Artículo 30 de la Decisión 486.

Novedad

Ese Despacho considera que el documento D1 (WO 03/035005) afecta la novedad de los derivados de indazol reivindicados.

Con las modificaciones del pliego reivindicatorio se supera la falta de novedad de los compuestos reivindicados, toda vez que la limitación de R2 es novedosa con respecto a D1, en donde alquil (C₁-C₆)- fenilo o tetrametil-tetrahidronaftaleno no se enseña en dicha posición.

Adicionalmente, la limitación de NR2R3 formando un sistema de anillo monocíclico análogo al de la antigua reivindicación 4 también es novedosa frente a D1, en donde no se enseña ni la sustitución del anillo ni la sustitución en la posición 4 (ver reivindicación 1 de de D1). D1 tampoco enseña los sistemas de anillo bicíclico formado por NR2R3.

En conclusión, dadas las diferencias estructurales, es claro que D1 no comprende los compuestos reivindicados por la presente solicitud de patente y, por ende la misma cumple con el requisito de novedad estipulado por el Artículo 16 de la Decisión 486.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 10 - 38,381
FECHA : MAYO 12 DE 2010

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-074367- -00005-0000

Fecha: 2010-05-19 14:21:45 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve. 379 FASENACIONALII
Act 444 RESPUESTAREQUE Folios: 9

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
ALVARO CASTELLANOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	130820664	12/05/2010	3,930,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LEMAS COMERCIALES	114,000.00
		TOTAL :	\$ 114,000.00

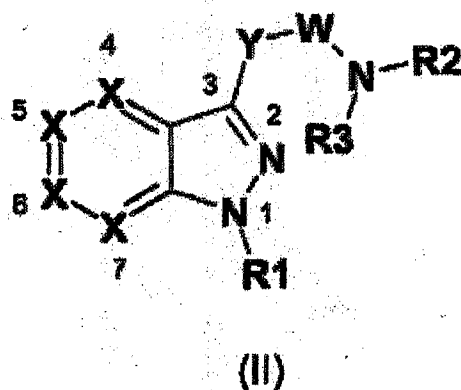
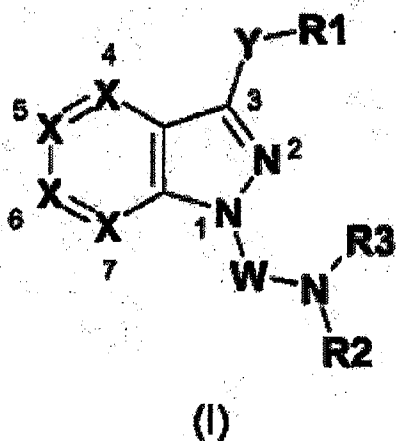
SON: CIENTO CATORCE MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

REIVINDICACIONES

1. Un derivado de indazol de las fórmulas I o II



en los que los significados son:

W -(C=O)-,

X =C(-R)- o =N-;

Y -O-

R hidrógeno, halógeno, alquilo-(C₁-C₆), alquiloxi-(C₁-C₃)-alquilen-(C₁-C₃), hidroxil, alquil-(C₁-C₆)-mercapto, amino, alquil-(C₁-C₆)-amino, di-alquil-(C₂-C₁₂)-amino, mono-alquil-(C₁-C₆)-aminocarbonilo, di-alquil-(C₂-C₈)-aminocarbonilo, COOR₄, ciano, trifluorometilo, alquil-(C₁-C₆)-sulfonilo, alquil-(C₁-C₆)-sulfinilo, aminosulfonilo, nitro, pentafluorosulfonilo, arilo-(C₆-C₁₀), CO-NR₂'R₃', O-CO-NR₂'R₃', O-CO-alquilen-(C₁-C₆)-CO-O-alquilo-(C₁-C₆), O-CO-alquilen-(C₁-C₆)-CO-OH, O-CO-alquilen-(C₁-C₆)-CO-NR₂'R₃' o alquiloxi-(C₁-C₆) sin sustituir o mono- o poli-sustituido por F;

R₁ H, alquilo-(C₁-C₆), bencilo;

R₂' H, alquilo-(C₁-C₆), alquil-(C₁-C₄)-fenilo, arilo-(C₆-C₁₀), donde el fenilo o el arilo pueden estar sustituidos por alógeno, alquilo-(C₁-C₆), alquiloxi-(C₁-C₃), hidroxil, alquil-(C₁-C₆)-mercapto, amino, alquil-(C₁-C₆)-amino, di-alquil-(C₂-C₁₂)-amino, mono-alquil-(C₁-C₆)-aminocarbonilo, di-alquil-(C₂-C₈)-aminocarbonilo, alcoxi-(C₁-C₆)-carbonilo, ciano, trifluorometilo, trifluorometiloxi, alquil-(C₁-C₆)-sulfonilo, aminosulfonilo, nitro; o R₂ es tetrametil-tetrahidronaftaleno;

R₃' H, alquilo-(C₁-C₆);

R₂ alquil-(C₁-C₄)-fenilo, en donde el fenilo puede estar substituido por halógeno, alquilo-(C₁-C₆), alquiloxi-(C₁-C₃), hidroxil, alquil-(C₁-C₆)-mercapto, amino, alquil-(C₁-C₆)-amino, di-alquil-(C₂-C₁₂)-amino, mono-alquil-(C₁-C₆)-aminocarbonilo, di-alquil-(C₂-C₈)-aminocarbonilo, alcoxi-(C₁-C₆)-carbonilo, ciano, trifluorometilo,

trifluorometiloxi, alquil-(C₁-C₆)-sulfonilo, aminosulfonilo, nitro; o R₂ es tetrametil-tetrahidronaftaleno;

R₃ H, alquilo-(C₁-C₆);

R₂ y R₃ pueden formar, junto con el átomo de nitrógeno que los porta, un sistema de anillo de 4 a 7 miembros monocíclico que comprende en la posición 4 un átomo o miembro atómico de la serie -CHR₅-, -CR₅R₅-, -(C=R₅)-, -NR₅-, -O-, -S-; o un sistema de anillo de 8 a 14 miembros bicíclico saturado o parcialmente insaturado, en los que los miembros individuales de los sistemas de anillo pueden reemplazarse por uno a tres átomos o grupos atómicos de las series -CHR₅-, -CR₅R₅-, -(C=R₅)-, -NR₅-, -C(=O)-, -O-, -S-, -SO-, -SO₂-, con la condición de que dos unidades de las series -O-, -S-, -SO-, -SO₂- puedan no ser adyacentes;

R₄ hidrógeno, alquilo-(C₁-C₆), bencilo;

R₅ alquilo-(C₁-C₆), halógeno, trifluorometilo, COOR₄, ciclopropilo, ciclopropileno;

y las sales de éstos toleradas fisiológicamente así como sus formas tautoméricas.

2. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, en los cuales

NR₂R₃ es un sistema de anillo de 5 a 6 miembros monocíclico saturado el cual comprende en la posición 4 un átomo o miembro atómico de la serie -CHR₅-, -CR₅R₅-, -(C=R₅)-, -NR₅-, -O-, -S-;

3. Compuestos de acuerdo con las reivindicaciones 1 o 2 en los cuales

X en la posición 4, 5 y 7 es =C(-R)- con R= hidrógeno

4. Compuestos de conformidad con las reivindicaciones 1 a 3, en los cuales

W es -(C=O)-;

X es =C(-R)- o =N-;

Y es -O-;

R es hidrógeno, halógeno, alquilo-(C₁-C₆), hidroxilo, amino, COOR₄, trifluorometilo, alquil-(C₁-C₆)-sulfonilo, nitro, pentafluorosulfonilo, arilo-(C₆-C₁₀), CO-NR₂'R₃', O-CO-NR₂'R₃' u O-CO- alquilen-(C₁-C₆)-CO-O-alquilo-(C₁-C₆);

- R1 es H, alquilo-(C₁-C₆), bencilo;
- R2' es alquilo-(C₁-C₆), bencilo, arilo-(C₆-C₁₀) o tetrametil-tetrahidronaftaleno;
- R3' es H, alquilo-(C₁-C₆);
- R2 es bencilo o tetrametil-tetrahidronaftaleno;
- R3 es H, alquilo-(C₁-C₆); o
- R2 y R3 pueden formar, junto al átomo de nitrógeno que los porta, un sistema de anillo de 5 a 6 miembros monocíclico saturado que comprende en la posición 4 un átomo o miembro atómico de la serie -CHR5-, -CR5R5-, -(C=R5)-, -NR5-, -O-, -S-; o un sistema de anillo de 9 a 10 miembros bicíclico saturado o parcialmente insaturado en los que los miembros individuales de los sistemas de anillo pueden reemplazarse por uno a dos átomos o grupos atómicos de las series -CHR5-, -CR5R5-, -(C=R5)-, -NR5-, -O-, -S-, con la condición de que dos unidades de las series -O-, -S- puedan no ser adyacentes;
- R4 es hidrógeno, alquilo-(C₁-C₆) o bencilo;
- R5 es alquilo-(C₁-C₆), halógeno, trifluorometilo, COOR₄, ciclopropilo, ciclopropileno.

5. Compuestos de fórmula I de acuerdo con las reivindicaciones 1, 2 o 4 en los cuales

- W es -(C=O)-;
- X es =C(-R)- o =N-;
- Y es -O-;
- R es hidrógeno, halógeno, nitro, hidroxilo o alquilo-(C₁-C₆);
- R1 es H o alquilo-(C₁-C₆);
- R2' es alquilo-(C₁-C₆), bencilo o arilo-(C₆-C₁₀);
- R3' es alquilo-(C₁-C₆);
- R2 es bencilo;
- R3 es alquilo-(C₁-C₆); o
- R2 y R3 pueden formar, junto al átomo de nitrógeno que los porta, un sistema de anillo de 5 a 6 miembros monocíclico saturado que comprende en la posición 4 un átomo o miembro atómico de la serie -CHR5-, -NR5-; o un sistema de anillo de 9 a 10 miembros bicíclico saturado o parcialmente insaturado en los que los miembros individuales de los sistemas de anillo pueden reemplazarse por un átomo o un grupo atómico de las series -CHR5-, -NR5-; y
- R5 es alquilo-(C₁-C₆), o ciclopropilo.

6. Compuestos de la formula II de acuerdo con las reivindicaciones 1, 2 o 4, en los cuales

W es $-(C=O)-$;

X es $=C(-R)-$ o $=N-$;

Y es $-O-$;

R es hidrógeno, halógeno, alquilo- (C_1-C_6) , hidroxilo, amino, $COOR_4$, trifluorometilo, alquil- (C_1-C_6) -sulfonilo, nitro, pentafluorosulfanilo, arilo- (C_6-C_{10}) , $CO-NR_2'R_3'$, $O-CO-NR_2'R_3'$ u $O-CO$ -alquilen- (C_1-C_6) - $CO-O$ -alquilo- (C_1-C_6) ;

R1 es H, alquilo- (C_1-C_6) o bencilo;

R2' es alquilo- (C_1-C_6) , arilo- (C_6-C_{10}) o tetrametil-tetrahidronaftaleno;

R3' es H, alquilo- (C_1-C_6) ;

R2 tetrametil-tetrahidronaftaleno;

R3 es H, alquilo- (C_1-C_6) ;

R2 y R3 pueden formar, junto al átomo de nitrógeno que los porta, un sistema de anillo de 5 a 6 miembros monocíclico saturado que comprende en la posición 4 un átomo o miembro atómico de la serie $-CHR_5-$, $-CR_5R_5-$, $-(C=R_5)-$, $-NR_5-$, $-O-$, $-S-$;

o un sistema de anillo de 9 a 10 miembros bicíclico saturado o parcialmente insaturado en los que los miembros individuales de los sistemas de anillo pueden reemplazarse por uno o dos átomos o grupos atómicos de las series $-CHR_5-$, $-CR_5R_5-$, $-(C=R_5)-$, $-NR_5-$, $-O-$, $-S-$, con la condición de que dos unidades de las series $-O-$, $-S-$ puedan no ser adyacentes;

R4 es hidrógeno, alquilo- (C_1-C_6) , bencilo; y

R5 es alquilo- (C_1-C_6) , halógeno, trifluorometilo, $COOR_4$, ciclopropilo, ciclopropileno.

7. Compuestos de la formula II de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 6, en los cuales

NR2R3 es piperidina que comprende el miembro atómico CHR_5 en la posición 4.

8. Una composición farmacéutica que comprende uno o mas de los derivados de indazol de la formula I o II tal y como se reivindica en las reivindicaciones 1 a 7.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Radicación No. 06-074367

Clasificación Internacional (IPC): A61K 31/416

Concepto Técnico No. 2264

Patente de Invención

☒ Patente de Modelo de Utilidad



Vía Nacional

Vía PCT (fase nacional)



Cap. I



Cap. II



No. Sol. Internacional

PCT/EP2005/000365

Fecha de Presentación Internal.

Enero 15 de 2005

Como resultado del examen definitivo, realizado con fundamento en el artículo 48 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

1. Documentos estudiados:

- 1.1. Descripción: Folios: 43 a 76 como se radicó inicialmente
- 1.2. Reivindicaciones: Folios: 77 a 82 como se radicó inicialmente
Folios: 96 a 101 modificadas
Folios: 156 a 159 modificadas
- 1.3. Prioridad: DE No. 102004005172.0 del 02 de Febrero de 2004
- 1.4. Respuesta del solicitante a: A Primer 45 Folios: 151 a 159

2. Análisis de la Prioridad:

La prioridad es aceptada, dado que cumple con los requisitos establecidos.

3. Objeto de la invención

Título de la solicitud:

"DERIVADOS DE INDAZOL"

El objeto de la presente solicitud es la necesidad de proveer nuevos Derivados De Indazol de fórmulas (I) y (II), los cuales presentan un efecto inhibitorio sorprendente sobre la lipasa, que da lugar finalmente a una reducción de ácidos grasos libres en la sangre y de la glucosa sanguínea.

✓ Reivindicaciones 1 a 7: Un Derivado de Indazol de las fórmula (I) ó (II)

✓ Reivindicación 8: Composición farmacéutica de los compuestos de fórmula (I) ó (II)

El problema planteado en esta solicitud es el proveer derivados de Indazol; los cuales pueden utilizarse en alteraciones metabólicas, ya que presentan un efecto inhibitorio sorprendente sobre la lipasa, que da lugar finalmente a una reducción de ácidos grasos libres en la sangre y de la glucosa sanguínea.

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio presenta derivados de Indazol de fórmula (I) ó (II), y sus composiciones farmacéuticas.

El objeto de la invención definido anteriormente se clasifico de acuerdo con la IPC: A61K 31/416

4. De la solicitud de Patente:

4.1. Descripción (artículo 28 D. 486)

La descripción sí cumple con el requisito de claridad o comprensión de acuerdo al artículo 28 de la Decisión 486.

4.2. Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

El capítulo reivindicatorio sí cumple con el requisito de definición, claridad, concisión o sustento por la descripción de acuerdo al artículo 30 de la Decisión 486.

5. Unidad de invención (artículo 25 D 486)

La presente solicitud se refiere a una sola invención, así que la misma sí cumple con el requisito de unidad de invención de acuerdo al artículo 25 de la Decisión 486.

6 No es una invención (artículo 15 D 486 literal a)-f))

La materia objeto de la solicitud es considerada una invención.

7. Excepción a la patentabilidad (artículo 20 D486 literal a)-d)

La materia objeto de la solicitud es considerada patentable, puesto que no se encuentra dentro de la excepciones del artículo 20 de la Decisión 486.

8. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso (artículos 14 y 21 D 486)

La materia objeto de la solicitud no se refiere a usos, ya que esta referida a Derivados de Indazol los cuales presentan un efecto inhibitorio sorprendente sobre la lipasa, que da lugar finalmente a una reducción de ácidos grasos libres en la sangre y de la glucosa sanguínea y sus composiciones farmacéuticas.

9. 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 internacional: Febrero 02 de 2004; y una vez consultadas las bases de datos con que cuenta la oficina y las otras fuentes utilizadas para determinar el estado de la técnica no se encontró documento alguno relacionado con el objeto de la solicitud que pudiese afectar su patentabilidad.

10. Respuesta a los argumentos del solicitante:

Se aceptan los argumentos dados por el solicitante en lo que respecta a: claridad de las reivindicaciones, sustento descriptivo, el nuevo capítulo reivindicatorio presentado y novedad de la solicitud.

11. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

Se procedió a evaluar los requisitos de Novedad, Nivel Inventivo y Aplicación Industrial con el fin de establecer la patentabilidad de la invención reivindicada en la solicitud en estudio.

11.1 Novedad (artículo 16 D486)

Las reivindicaciones 1 a 8 se refieren a compuestos Derivados de Indazol de fórmulas (I) ó (II), los cuales presentan un efecto inhibitorio sorprendente sobre la lipasa, que da lugar finalmente a una reducción de ácidos grasos libres en la sangre y de la glucosa sanguínea y sus composiciones farmacéuticas.

Se realizó el estudio de novedad comparando elemento por elemento de los compuestos de fórmula (I) y sus composiciones farmacéuticas reivindicados en la presente solicitud con los presentes en el estado de la técnica relacionado.

Como resultado de dicho estudio no se encontró compuestos de fórmula (I) ó (II), ni composiciones farmacéuticas iguales a las de la presente solicitud, por lo tanto las reivindicaciones 1 a 8 cumplen con el requisito de novedad de acuerdo con el artículo 16 de la decisión 486.

11.2 Nivel inventivo (artículo 18 D486)

Las reivindicaciones 1 a 8 se refieren a compuestos Derivados de Indazol de fórmulas (I) ó (II), los cuales presentan un efecto inhibitorio sorprendente sobre la lipasa, que da lugar finalmente a una reducción de ácidos grasos libres en la sangre y de la glucosa sanguínea y sus composiciones farmacéuticas.

Se realizó el estudio de nivel inventivo, y como resultado de dicho estudio no se encontró compuestos Derivados de Indazol de fórmulas (I) ó (II) ni composiciones farmacéuticas que los afecten, constituye una ventaja y una solución inesperada nada obvia para una persona medianamente versada, los compuestos Derivados de Indazol de fórmula (I) ó (II) y sus composiciones farmacéuticas reivindicadas; por lo tanto la materia reivindicada se considera que tiene nivel inventivo de acuerdo a lo estipulado en el artículo 18 de la decisión 486.

11.1 Aplicación industrial (artículo 19 D 486)

La materia relacionada en las reivindicaciones 1 a 8, relacionadas con compuestos Derivados de Indazol de fórmulas (I) ó (II), los cuales presentan un efecto inhibitorio sorprendente sobre la lipasa, que da lugar finalmente a una reducción de ácidos grasos libres en la sangre y de la glucosa sanguínea y sus composiciones farmacéuticas; tienen Aplicación Industrial.

12. Conclusión:

En consecuencia y por todo lo expuesto anteriormente, se recomienda conceder las Reivindicaciones 1 a 8 (folios 156 a 159); sugiriendo que el título sea:

"DERIVADOS DE INDAZOL DE FORMULA (II) Y (II) Y SUS COMPOSICIONES FARMACEUTICAS", acorde con la materia a patentar.

Bogotá, D.C.,

CONCEPTO TECNICO No. 2264	EXAMINADOR TECNICO Código No. 202080
---------------------------	---