

**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

**RESOLUCIÓN No: 11751**

*Por la cual se deniega una patente de invención*

Rad. PCT/06-108716

**EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las que se confirieron en el artículo 3, numeral 26, del Decreto 4886 de 2011, y

**CONSIDERANDO:**

**PRIMERO:** Que mediante escrito radicado ante esta Superintendencia el 25 de octubre de 2006 con el N° 06-108716-00000-0000, por la sociedad MEMORY PHARMACEUTICALS CORPORATION, a través de apoderado, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "INDAZOLES, BENZOTIAZOLES, BENZOISOTIAZOLES, BENZISOXAZOLES Y PREPARACIÓN Y USOS DE ESTOS", que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2005/010120 del 25 de marzo de 2005.

**SEGUNDO:** Que efectuado el examen de forma, con fundamento en el artículo 39 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, en concordancia con el Tratado de Cooperación en materia de patentes (PCT), el reglamento y la Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se ordenó publicar el extracto sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

**TERCERO:** Que realizado el examen de patentabilidad con fundamento en lo dispuesto en el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se requirió a la solicitante mediante Oficio N° 662, notificado el 14 de enero de 2011, para que se pronunciara sobre las objeciones efectuadas a la solicitud, en cuanto a la carencia de novedad, conforme lo establece el artículo 16 de la Decisión 486 anteriormente mencionada.

**CUARTO:** Que la solicitante mediante escrito radicado bajo el N° 06-108716-00014-0000 del 24 de mayo de 2011, respondió oportunamente el requerimiento formulado, y presentó nuevas reivindicaciones 1 a 13 (Fls. 733 a 737) que reemplazan las originalmente presentadas, atendiendo de esta manera las observaciones efectuadas en el examen de fondo. Se aceptó el nuevo capítulo reivindicatorio presentado, comoquiera que se ajusta a las prescripciones contenidas en el artículo 34 de la Decisión 486.

**QUINTO:** Que según lo dispuesto en el artículo 14 de la Decisión 486 expedida por la Comisión de la Comunidad Andina se otorgarán patentes "(...) para las invenciones, sean de producto o de procedimiento, en todos los campos de la tecnología, siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial".

u

**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

**RESOLUCIÓN No: 11751**

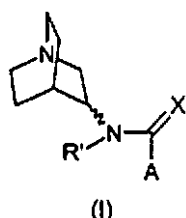
*Por la cual se deniega una patente de invención*

Rad. PCT/06-108716

**SEXTO:** Que las reivindicaciones 1 a 13 contenidas en los folios 733 a 737, no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

**6.1. Objeto de la invención.**

El objeto de la invención consiste en la necesidad de suministrar compuestos que actúen como ligandos del receptor del subtipo 7 nACh para el tratamiento de enfermedades asociadas con receptores nicotínicos de acetilcolina defectuosos o con un funcionamiento incorrecto. Para solucionar este problema la solicitud en estudio proporciona compuestos de la fórmula (I):



**6.2 Determinación del estado de la técnica.**

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 25 de marzo de 2004, que corresponde a la fecha de la prioridad invocada.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos anteriores a la fecha de reivindicación de prioridad, relacionados con la materia de la solicitud en estudio:

| No. | Documento     | Título                                                                                               | Fecha de publicación |
|-----|---------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------|
| D1  | WO02100858    | "Quinuclidine-substituted heteroaromatic compounds as ligands at nicotinic acetylcholine receptors". | 19/12/2002           |
| D3  | JP2002-030084 | "1-azabicycloalkane compound and pharmaceutical use thereof".                                        | 29/01/2002           |

**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

**RESOLUCIÓN No: 11751**

*Por la cual se deniega una patente de invención*

Rad. PCT/06-108716

El documento D1<sup>1</sup> divulga compuestos ligados de receptores nicotínicos 7 nACh derivados de 3-sustituido-1-azabicyclo[2.2.2]octano con sustituyentes indazol, 1,3-benzoxazol, 1,3-benzotiazol, 1,3-benzodioxol, 2-benzotiofeno, 1,3-benzotiazol (ejemplos páginas 43-62).

El documento D3<sup>2</sup> divulga en su descripción compuestos derivados de quinuclidina caracterizados por ser agonistas o agonistas parciales del receptor -nicotínico, establece que los sustituyentes sobre Y pueden ser un heterociclo aromático de 2 ciclos en los cuales puede haber un anillo heterocíclico y un benceno condensados (párrafo [0013]) los cuales se pueden unir a Y por cualquiera de los átomos de carbono del anillo. Adicionalmente enseña que dichos compuestos pueden estar sustituidos por una variedad de diferentes sustituyentes entre los cuales se encuentran metoxi y trifluorometil (párrafo [0014]).

**6.3. Nivel inventivo.**

Según lo dispuesto en el artículo 18 de la Decisión 486:

*"Se considerará que una invención tiene nivel inventivo, si para una persona del oficio normalmente versada en la materia técnica correspondiente, esa invención no hubiese resultado obvia ni se hubiese derivado de manera evidente del estado de la técnica".*

*"El estado de la técnica comprenderá todo lo que haya sido accesible al público por una descripción escrita u oral, utilización, comercialización o cualquier otro medio antes de la fecha de presentación de la solicitud de patente o, en su caso, de la prioridad reconocida".*

En el presente caso, los compuestos reclamados en la solicitud no poseen nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 está referida a: un compuesto aza-biciclo octano que tiene fórmula seleccionada de la fórmula I:

<sup>1</sup>[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=worldwide.espacenet.com&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20021219&CC=WO&NR=02100858A2&KC=A2)

[DB=worldwide.espacenet.com&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en\\_EP&FT=D&date=20021219&CC=WO&NR=02100858A2&KC=A2](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=worldwide.espacenet.com&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20021219&CC=WO&NR=02100858A2&KC=A2)

<sup>2</sup>[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=JP&NR=2002030084A&KC=A&FT=D&ND=4&date=20020129&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP)

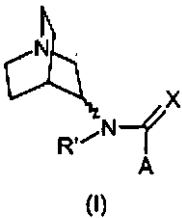
[CC=JP&NR=2002030084A&KC=A&FT=D&ND=4&date=20020129&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en\\_EP](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=JP&NR=2002030084A&KC=A&FT=D&ND=4&date=20020129&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP)

REPÚBLICA DE COLOMBIA  
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 11751

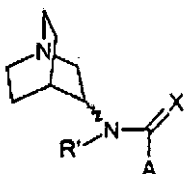
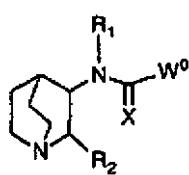
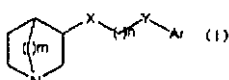
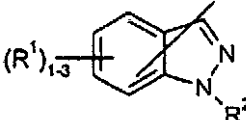
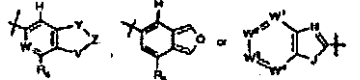
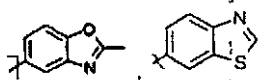
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/06-108716



(FI.733).

La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la reivindicación 1, y las reveladas en los documentos D1 y D3 que representan el estado de la técnica:

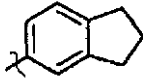
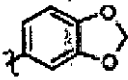
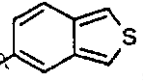
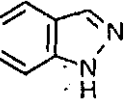
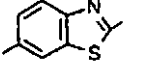
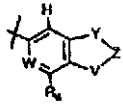
| Características esenciales                                                                                                                                                    | D1                                                                                                                                                                                                                                                     | D3                                                                                                                                                                                 |
|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| <div><p>(I)</p></div>                                                                      | <div></div>                                                                                                                                                         | <div><p>(1)</p></div>                                                                         |
| <div>A es:<br/><p>A está unida al resto del compuesto a través de la posición 3.</p></div> | <div>W<sup>0</sup>:<br/><p>entre los cuales se encuentran:</p><div></div></div> | <div>En donde: m es 2 (quinuclidina)<br/>X es NH, n es 0,<br/>ó m es 2 (quinuclidina)<br/>Y<br/>Ar es un heterociclo aromático que tiene dos anillos en los cuales el anillo</div> |

REPÚBLICA DE COLOMBIA  
 SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

**RESOLUCIÓN No: 11751**

*Por la cual se deniega una patente de invención*

Rad. PCT/06-108716

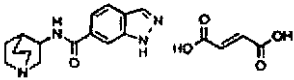
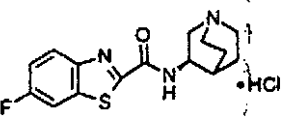
|  |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       |                                                                                                                                  |
|--|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | <div style="display: flex; justify-content: space-around;">   </div> <div style="display: flex; justify-content: space-around; margin-top: 10px;">   </div> <div style="display: flex; justify-content: space-around; margin-top: 10px;">  </div> <p style="margin-top: 20px;">W<sup>o</sup> puede ser:</p> <div style="text-align: center; margin: 10px 0;">  </div> <p>Donde</p> <p style="margin-left: 40px;">X: O</p> <p style="margin-left: 40px;">W: CH</p> <p style="margin-left: 40px;">V-Z-Y: N(R<sub>4</sub>)-N=C(R<sub>5</sub>)</p> <p style="margin-left: 40px;">R<sub>4</sub>: H</p> <p style="margin-left: 40px;">R<sub>5</sub>: H o OR<sub>1</sub></p> <p style="margin-left: 40px;">R<sub>1</sub>: alquil halogenado</p> <p style="margin-left: 40px;">R<sub>6</sub>: H, CF<sub>3</sub> o -OR<sub>16</sub></p> <p style="margin-left: 40px;">R<sub>16</sub>: Alquil sustituido,<br/>heterocicloalquil, fenil sustituido...<br/>etc.</p> | <p>heterocíclico puede estar condensado con un benceno.</p> <p style="text-align: center; margin-top: 20px;">(párrafo [009])</p> |
|--|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|

REPÚBLICA DE COLOMBIA  
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 11751

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/06-108716

|                                                                                                                |                                                                                                                                                                                                                                         |                                                                                                           |
|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|                                                                                                                | <div><div>Ejemplo 14</div></div> <div><div>Ejemplo 1002</div></div> |                                                                                                           |
| X: O                                                                                                           | X: O                                                                                                                                                                                                                                    | Y es C(O).<br><br>(se forma el grupo NH-C(O))                                                             |
| R <sup>1</sup> : etinil, fenoxi, pent-1-in-il, feniletinil, [2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-(trifluorometil)etil] | R <sup>6</sup> : H, CF <sub>3</sub> o -OR <sub>16</sub> , N(R <sub>16</sub> ) <sub>2</sub><br><br>R <sup>16</sup> : Fenil sustituido, Alquil sustituido, heterocicloalquil,                                                             | Como sustituyentes del heterociclo aromático bicíclico se establecen: Alquilo fluorado, alquiltio... etc. |

El documento D1 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga compuestos ligandos de receptores nicotínicos 7nACh derivados de 3-sustituido-1-azabicyclo[2.2.2]octano con sustituyentes indazol, 1,3-benzoxazol, 1,3-benzotiazol, 1,3-benzodioxol, 2-benzotiofeno, 1,3-benzotiazol, los cuales pueden tener o no tener sustituyentes sobre el anillo de benceno.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1, y los compuestos revelados en D1, es que la presente invención reclama específicamente compuestos que se unen al grupo amida por el carbono 3 del indazol. Sin embargo no se demuestra que al incluir esta

**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

**RESOLUCIÓN No: 11751**

*Por la cual se deniega una patente de invención*

Rad. PCT/06-108716

característica se logre algún efecto inesperado.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo modificar los compuestos revelados en D1 para obtener compuestos alternativos que sean ligandos de receptores nicotínicos 7 nACh"

No obstante lo anterior, cabe aclarar que, el documento D3 ya revelaba compuestos derivados de quinuclidina los cuales son agonistas o agonistas parciales del receptor alfa-7 nicotínico. Los compuestos de quinuclidina (cuando m es 2), donde un grupo carboxamida (cuando X es NH, n es 0, Y es C(O), o un grupo aminometilo (cuando X es NH, n es 0 y Y es CH<sub>2</sub>) (ver folio 240 párrafo [0010], pueden estar sustituidos por anillos heteroarilos bicíclicos como benzotiazol, 1,2-benzisotiazol, indol, benzofurano, benzotiofeno, quinolina, isoquinolina, entre otros (ver folio 241 párrafo [0013]), donde dicho anillo heteroarilo bicíclico, puede unirse por cualquier átomo de carbono con Y (CO) o CH<sub>2</sub> (Ver párrafo [0013], última línea) y puede tener diferentes sustituyentes (ver párrafo [0014]).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría esta característica de D3 (que revela que los grupos heteroarilo bicíclico se pueden unir al grupo farmacofórico carbamoil-quinuclidina por cualquier átomo de carbono) a los compuestos de D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia y más aun teniendo en cuenta que los compuestos de la actual solicitud presentan la misma actividad de los compuestos revelados tanto en D1 como en D3, en tal virtud los compuestos reivindicados no cumplen con el requisito de nivel inventivo.

Por su parte, las reivindicaciones dependientes 2 a 13 no mencionan alguna característica que le confieran nivel inventivo a los compuestos de la reivindicación 1, por lo tanto, tampoco cumplen con lo establecido en el mencionado artículo 18 de la Decisión 486.

En conclusión, teniendo en cuenta que los argumentos de la solicitante no desvirtúan de manera alguna las objeciones a la patentabilidad ya sustentada, el Superintendente de Industria y Comercio,

**RESUELVE:**

**ARTÍCULO PRIMERO:** Denegar la patente de invención a la creación titulada "INDAZOLES, BENZOTIAZOLES, BENZOISOTIAZOLES, BENZISOXAZOLES Y PREPARACIÓN Y USOS DE ESTOS".

**ARTÍCULO SEGUNDO:** Notificar personalmente el contenido de la presente resolución a la doctora Margarita Castellanos Abondano, en su calidad de apoderada de MEMORY PHARMACEUTICALS CORPORATION, o a quien haga sus veces, entregándole copia de la misma y advirtiéndole que contra ella procede el recurso de reposición, ante el

**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

**RESOLUCIÓN No: 11751**

*Por la cual se deniega una patente de invención*

Rad. PCT/06-108716

Superintendente de Industria y Comercio, el cual podrá ser interpuesto en el momento de la notificación o dentro de los 5 días hábiles siguientes a ella.

**NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE**

Dada en Bogotá D.C., a los 29 Feb 2012

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO (E),



**ADOLFO LEÓN VARELA SÁNCHEZ**

Docentes

MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO

Calle 94 A N° 7 A - 02.

Bogotá D.C.

Elaboró: Juanita Catalina Rico Valbuena ✓  
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Roza ✓  
Revisó: Jesus Fernel Garcia Garcia ✓  
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez ✓  
Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez ✓