

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 13-14079- -4	FECHA: 2014-01-24 11:05:24
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 7
ACT: 519 PRESENTACION	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO

Asunto: Radicación: 13-14079- -4
 Trámite: 11
 Evento: 378
 Actuación: 519
 Oficio: 678
 Folios: 7

Patente de Invención	X			Patente de Modelo de Utilidad	
Vía Nacional					
Vía PCT (Fase Nacional)	X	Capítulo I	X	Capítulo II	
No. Solicitud Internacional	PCT/EP2011/061586				
Fecha de Presentación Internacional	08/07/2011				

1. Documentos estudiados

Descripción:	Radicado N°13-014079-00000-0000	Enero 25 de 2013
Reivindicaciones	Radicado N°13-014079-00000-0000	Enero 25 de 2013
Prioridad:	EP 10169107.9	Julio 9 de 2010
	US 61/362,784	Julio 9 de 2010
	EP 11156007.4	Febrero 25 de 2011
	US 61/446,541	Febrero 25 de 2011

2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de Prioridad porque esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

3. Objeto de la invención

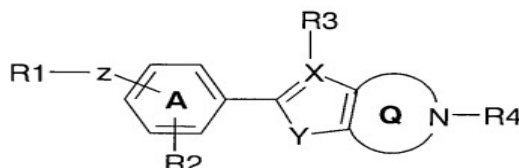
De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del Capítulo Primero del Título 10 de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por el solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es que cuando la solicitud contenga más de diez (10) reivindicaciones y no se haya pagado la tasa complementaria, sólo se estudiarán las cubiertas por la tasa pagada.

Por lo tanto, las reivindicaciones 1 a 17 del Radicado N°13-014079-00000-0000 son aceptadas para ser estudiadas, porque se registra el pago por las reivindicaciones adicionales 11 a 17, de acuerdo con el recibo presente en la página 4 del radicado N°13-014079-00000-0000.

Título de la solicitud: “Derivados heterocíclicos fusionados como moduladores S1P”

El problema planteado en esta solicitud consiste en la obtención de compuestos alternativos como moduladores de la Esfingosina – 1 – Fosfato (S1P), para el tratamiento de diversas enfermedades del SNC.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio plantea la obtención de compuestos heterocíclicos de Fórmula I, como moduladores de la Esfingosina – 1 – Fosfato (S1P), para el tratamiento de diversas enfermedades del SNC.



El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K31/429; A61K31/4355; A61K31/4365; A61K31/437; A61K31/55; A61P25/28; C07D487/04; C07D491/04; C07D498/04; C07D513/04

4. Reivindicaciones relativas al uso o a un segundo uso (Arts. 14 y 21 D 486)

El uso de las reivindicaciones 12 a 14, 16 y 17 no es patentable, de acuerdo con el Art 14

5. De la Solicitud de la Patente

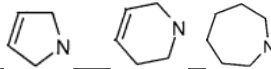
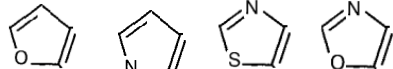
Título

El título de la presente solicitud se considera muy general y ambiguo, porque al mencionar “compuestos heterocíclicos”, se incluyen muchísimos compuestos que cumplen con esta característica pero no están incluidos en el objeto de la presente invención. Se solicita modificar el título de esta solicitud, de acuerdo con las observaciones mencionadas anteriormente.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 no es concisa, porque se mencionan sustituyentes, los cuales a pesar de ser la restricción a partir de una generalidad, tales como “alquilo C₁₋₄ sustituido por uno o más átomos de F, alqueno C₂₋₄, alquino C₂₋₄, cicloalquilo C₃₋₆, cicloalqueno C₄₋₆, biciclo C₈₋₁₀, entre otros”, de tal forma que a partir del empleo de los sustituyentes mencionados anteriormente, se obtiene una cantidad amplia de compuestos y por lo tanto la complejidad de la solicitud es demasiado alta y por lo tanto no es posible establecer el verdadero alcance de lo que se desea proteger. Se solicita realizar una restricción más razonable y específica de los sustituyentes, de forma tal que a partir de los mismos se obtengan los compuestos de real interés para el inventor y que constituyen la solución al problema técnico objetivo planteado en la presente invención. El objetivo es que el solicitante mencione estructuras específicas de cada sustituyente posible dentro de la prosa de la reivindicación (esto quiere decir que en vez de mencionar alquilo C₁₋₄, se mencione metil, etil, propil, butil, isopropil, tercbutil; en vez de mencionar una amina cíclica de 5, 6, 7 miembros, mencionar si es pirrol, piridina, pirrolidina, piperidina, azepina; así sucesivamente con los demás sustituyentes definidos en la reivindicación 1).

Es cierto que el inventor está en su legítimo derecho de proteger su invención en la extensión que lo estime conveniente siempre y cuando se conserve el mismo concepto inventivo, sin embargo, de acuerdo al artículo 30 de la decisión 486, las reivindicaciones que detallan el objeto de la invención deben ser claras, concisas y debidamente soportadas dentro del capítulo descriptivo. Se sugiere respetuosamente al solicitante que utilice como referencia para realizar la restricción de los sustituyente más detallada y específica, de acuerdo a lo mencionado en el capítulo descriptivo y divulgado en la siguiente tabla, de tal manera que no se considere como una obligación, sino como una guía:

Sustituyente	Soportado en la descripción
Q	
X e Y forman	
Z	CH ₂ O, CH ₂ N, NH, CH ₂ , O, S, SO ₂ , CH ₂ SO ₂
R1	Fenilo, ciclohexilo, piridilo (opcionalmente sustituidos 1 o dos veces por Cl, F o CF ₃)
R2	H, Cl, F, CH ₃ , CF ₃ ,
R3	H o ausente
R4	(CH ₂) ₂ COOH, (CH ₂) ₃ COOH

Para las reivindicaciones 2 y 8, se solicita realizar la misma restricción para todos los sustituyentes, de acuerdo a lo requerido dentro de la reivindicación 1, de tal manera que estos sean mucho más específicos con respecto a lo mencionado en la reivindicación principal.

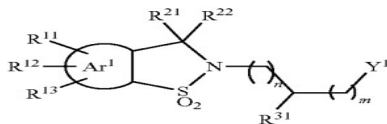
Para las reivindicaciones 3 y 4, mencionar las características técnicas esenciales para los sustituyentes de las estructuras mencionadas, de tal manera que estas sean específicas, de acuerdo con el requerimiento realizado a los compuestos de la reivindicación 1

6. Determinación del Estado de la Técnica

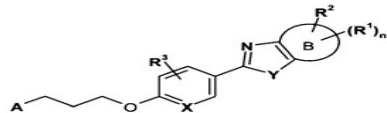
El Estado de la Técnica se determinó con base en la fecha de solicitud de prioridad: El 9 de julio de 2010 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	US20090192154	"Sultam derivatives"	Julio 30 de 2009
D2	WO2008012010	"Fused oxazoles and thiazoles as histamine H3 receptor ligands"	Enero 31 de 2008

El documento D1¹ divulga compuestos derivados de Sultam, para el tratamiento de la osteoartritis.



El documento D2² divulga compuestos derivados de oxazol y de tiazol fusionados, como inhibidores del receptor de Histamina H3, para el tratamiento de diversas patologías neurológicas.



1 [http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2009192154A1&KC=A1&FT=D&ND=&date=20090730&DB=&locale=en_EP)

CC=US&NR=2009192154A1&KC=A1&FT=D&ND=&date=20090730&DB=&locale=en_EP

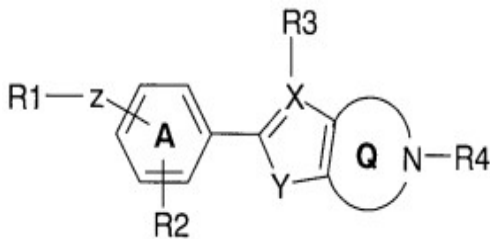
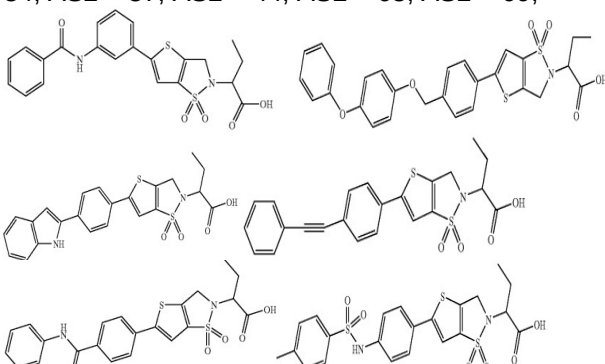
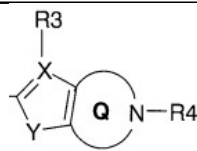
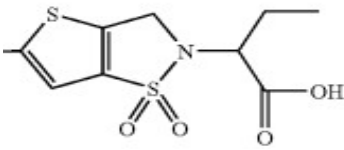
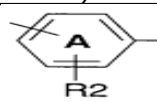
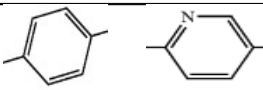
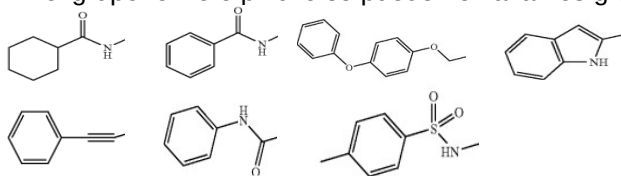
2 [http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2008012010A1&KC=A1&FT=D&ND=&date=20080131&DB=&locale=en_EP)

CC=WO&NR=2008012010A1&KC=A1&FT=D&ND=&date=20080131&DB=&locale=en_EP

7. Examen de Patentabilidad.

Novedad (Art 16 D 486)

La reivindicación 1 divulga un derivado heterocíclico de la fórmula (I), en donde...
 (Páginas 186 y 187 del radicado N° 13-014079-00000-0000)

Solicitud	D1
Compuesto de la Fórmula I 	Compuestos de la fórmulas AS2 – 14, AS2 – 22, AS2 – 34, AS2 – 37, AS2 – 44, AS2 – 63, AS2 – 69, 
 Donde X es CR ₃ (R ₃ es H); Y es S; Q es una amina cíclica; R ₄ es alquilen (C ₁₋₄)R ₅ (R ₅ es COOH)	
 Donde A es fenilo, donde este puede contener un N; R ₂ es H o halogeno	
R ₁ – Z – Donde R ₁ es fenilo, cicloalquilo C ₃₋₆ o un biciclo; Z es W – (alquilen) _n – T (W es enlace, C=O, NH, O, C=C, C≡C, SO ₂ ; n es 0,1; T es enlace, NH, C=O)	En el grupo fenilo o piridilo se pueden enlazar los grupos 

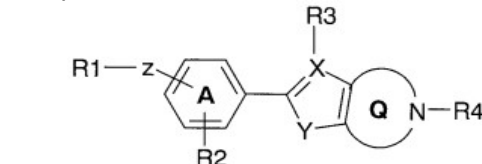
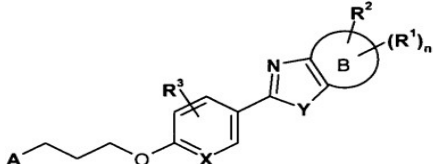
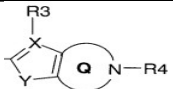
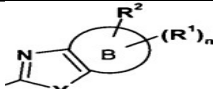
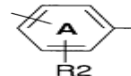
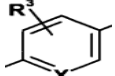
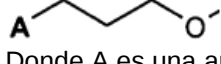
Las características técnicas esenciales de los compuestos mencionados en la reivindicación 1, han sido divulgadas previamente en D1 (D1: Páginas 69 a 81, tabla 1, compuestos AS2 – 013, AS2 – 014, AS2 – 015, AS2 – 016, AS2 – 019, AS2 – 022, AS2 – 034, AS2 – 035, AS2 – 037, AS2 – 038, AS2 – 042, AS2 – 043, AS2 – 044, AS2 – 061, AS2 – 062, AS2 – 063, AS2 – 064, AS2 – 065, AS2 – 069, AS2 – 074, AS2 – 075, AS2 – 076, AS2 – 077, AS2 – 078, AS2 – 079, AS2 – 085, AS2 – 086, AS2 – 087, AS2 – 088, AS2 – 089, AS2 – 091, AS2 – 093, AS2 – 094, AS2 – 096, AS2 – 097, AS2 – 099, AS2 – 103, AS2 – 104, AS2 – 106, AS2 – 111, AS2 – 113, AS2 – 117, AS2 – 119, AS2 – 120, AS2 – 121, AS2 – 122), donde se divulgan compuestos derivados de ácido 2 – [2 – (fenil) tieno [4,5-d] 1,1 – dioxo isotiazol] butanoico, como promotores de agregación de colágeno, para el tratamiento de la osteoartritis, con las características técnicas esenciales de la tabla anterior. Al mencionar Q como una amina cíclica, se constituye una generalidad, donde naturalmente se incluye como amina cíclica el 1, 1 – dioxo isotiazol.

En consecuencia, la reivindicación 1, de acuerdo con lo divulgado en D1, carece de Novedad.

Las reivindicaciones 2, 3, 6 a 9, 11 y 15, dependientes de la reivindicación 1, no

divulgan características nuevas adicionales a los compuestos de la reivindicación 1. Por lo tanto, estas reivindicaciones también carecen de Novedad.

La reivindicación 1 divulga un derivado heterocíclico de la fórmula (I), en donde... (Páginas 186 y 187 del radicado N° 13-014079–00000–0000)

Solicitud	D2
Compuesto de la Fórmula I 	Compuesto de la Fórmula I 
 Donde X es N (R3 está ausente); Y es O ó S; Q es una amina cíclica; R4 es alquilen (C₁₋₄)R5 (R5 es COOH)	 Donde B es anillo de tetrahidropiridinil o tetrahidroazepinil, Y es O ó S; R¹ es alquil (C₁₋₆) carboxi; R² es H
 Donde A es fenilo, donde este puede contener un N; R2 es H o halogeno	 Donde X es CH o N; R³ es H o halogeno
R1 – Z – Donde R1 es heterociclo monocíclico; Z es W – (alquilen)_n – T (W es enlace; n es 3; T es O)	 Donde A es una amina cíclica

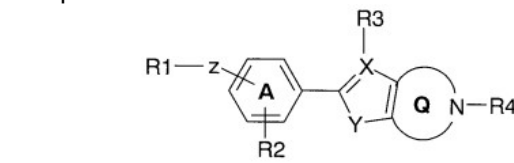
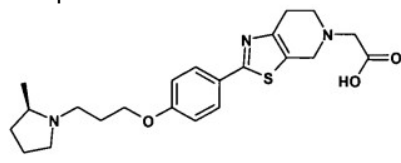
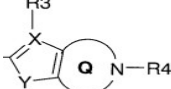
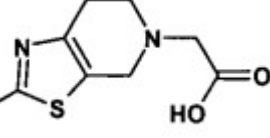
Las características técnicas esenciales de los compuestos mencionados en la reivindicación 1, han sido divulgadas previamente en D1 (D1: Páginas 149 y 150, reivindicaciones 1 a 6), donde se divulgan compuestos derivados de la fórmula I, como ligandos del receptor de Histamina H3, para el tratamiento de enfermedades del SNC, con las características técnicas esenciales de la tabla anterior.

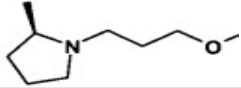
En consecuencia, la reivindicación 1, de acuerdo con lo divulgado en D2, carece de Novedad.

Las reivindicaciones 3, 4, 5, 6 y 15, dependientes de la reivindicación 1, no divulgan características nuevas adicionales a los compuestos de la reivindicación 1. Por lo tanto, estas reivindicaciones también carecen de Novedad.

Nivel Inventivo (Art 18 D 486)

La reivindicación 1 divulga un compuesto representado por la fórmula (I), caracterizado porque (Páginas 186 y 187 del capítulo reivindicatorio del radicado N° 13-014079–00000–0000)

Solicitud	D2
Compuesto de la Fórmula I 	Compuesto 98 
 Donde X es N (R3 está ausente); Y es S; Q es una amina cíclica; R4 es alquilen (C₁₋₄)R5 (R5 es COOH), que puede ser CH₂COOH	

R1 – Z – Donde R1 es fenilo o heterociclo monociclico; Z es W – (alquilen) _n – T (W es enlace; n es 3; T es O)	
--	--

D2 es considerado el Estado de la Técnica más cercano a la presente invención, definida en la reivindicación 1, porque se divulgan el compuesto acido 2 – {2 – [4 – (2 – metilpirrolidin – 2 – il) propoxifenil] tiazolo [4,5-c] piperidin – 6 – il} acético, para el tratamiento de diversas enfermedades del SNC (D3: Página 110, ejemplo 98).

La diferencia entre los compuestos divulgado en la presente invención con respecto al definido en D2, radica en que los compuestos de la presente invención, el anillo Q puede ser azepina o pirrolidina y R1 es preferiblemente fenilo, mientras que para los compuestos definidos en D1, el anillo fusionado es piperidina y como sustituyente del grupo 4 – fenil propoxi es 2 – metilpirrolidina.

Esta diferencia al parecer no concede ningún efecto técnico ventajoso o inesperado a los compuestos de la presente invención con respecto al divulgado en D2.

El Problema Técnico Objetivo que se pretende resolver es el siguiente: Como modificar los compuestos divulgados en D2 para obtener compuestos alternativos derivados acido

2 – [2 – (4 – fenil) tiazolo [4,5-c] piperidin – 6 – il] acético, con utilidad para el tratamiento de diversas patologías del SNC?

D2 divulga en las páginas 66, compuesto 45 y en la página 68, compuesto 46, compuestos donde el núcleo puede ser tiazolo [4,5-c] pirrolidina o tiazolo [4,5-d] azepina. Además, se menciona en la página 149, reivindicación 1, línea 6 que A es una amina cíclica (que puede ser piridina)

Por lo tanto, una persona medianamente versada en la materia y conocedora de los conceptos divulgados en D2, sin ningún esfuerzo modificaría el anillo tiazolo [4,5-c] pirrolidina por los otros nucleo divulgados en D1, así como permutaría el anillo de pirrolidina A por otra amina cíclica (que puede ser piridina) y teniendo en cuenta su equivalencia bioisostera con el grupo fenilo, esta persona versada en la materia basada en este conocimiento básico, incluiría el grupo fenilo, para obtener de esta forma los compuestos propuestos en la presente invención, de manera obvia o evidente.

En consecuencia, la reivindicación 1 de acuerdo a lo divulgado en D2, carece de Nivel Inventivo

Las reivindicaciones 2 a 11 y 15, dependientes de la reivindicación 1, no mencionan características inventivas adicionales para los compuestos de la reivindicación 1. Por lo tanto, estas reivindicaciones carecen de Nivel Inventivo

8. Conclusión

Los requisitos de Patentabilidad de la presente Solicitud están afectados así:

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2006038111	1 a 3, 6 a 9, 11 y 15	Novedad
D2	EP0701819	1, 3 a 6 y 15	Novedad
D2	WO2008004117	1 a 11 y 15	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 sesenta (60) días contados a partir del día siguiente 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.

Se invita al solicitante se sirva indicar, si así lo considera, su renuncia al término faltante de sesenta (60) días para dar respuesta a este requerimiento y presentarla por escrito.

Finalmente, se le recuerda al solicitante que si como respuesta a este requerimiento llegara a modificar el capítulo reivindicatorio y éste contenga más de diez (10) reivindicaciones, no pagará la tasa de modificación voluntaria pero sí la correspondiente al pago por reivindicación adicional.

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 No. 10 de 2001.



JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ
Director de Nuevas Creaciones (c)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 2014-01-28

Elaboró: Dayron Alexander Ramirez Reyes
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Roza