

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA  
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-039668- -00012-0000

Fecha: 2011-08-31 9:54:25 Dep. 2020 DIR.NUEVASCRE  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI  
Act. 372 INFORME Folios: 1

Radicación N° 07-39668

Clasificación Internacional de Patentes (IPC.): A61K31/553

KAM 401

Patente de Invención ☒

Vía PCT fase nacional ☒

Cap. I ☒

Cap. II ☐

No. Sol. Internacional

PCT/EP2005/034015

Fecha de Presentación Internal. 21/09/2005

Como resultado del examen de fondo, 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: 179 a 469 20/04/2007

1.2. Reivindicaciones: Folios: 470 a 485 20/04/2007

Folios: 533 a 534 14/12/2010

Folios: 557 a 558 01/06/2011

1.3 Prioridad: Folio 1: DK PA200500321, 03/03/2005

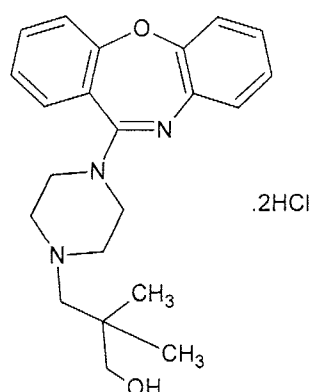
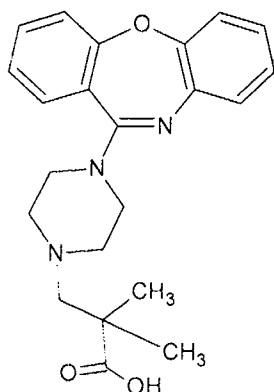
1.4 Respuesta del solicitante: Folios: 525 a 534 23/04/2010

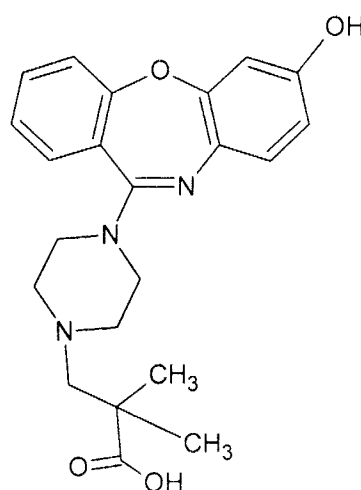
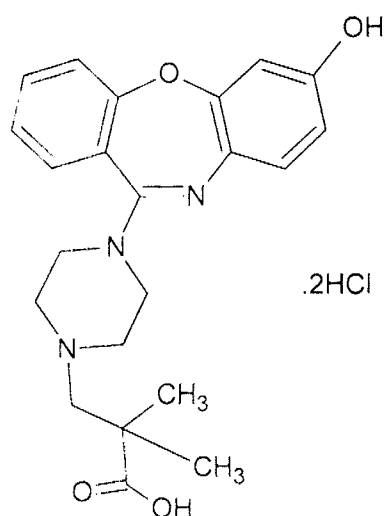
Folios: 550 a 558 01/06/2011

1. Objeto de la invención

Título de la solicitud: ANALOGOS DE OXAPINA Y MÉTODOS DE USO DE LOS MISMOS.

El objeto de la invención original es referido a los derivados de 11-(piperazin-1-il)dibenzo[b,f][1,4]oxazepina de fórmulas :





Ahora después del examen de patentabilidad se reclama:

- Reivindicaciones 1-4: El ácido 3-[4-(benzo[b][1,4]benzoxazepin-6-il)piperazin-1-il]-2,2-dimetilpropanoico y sus sales farmacéuticamente aceptables.
- Reivindicación 5: Composiciones que lo contienen.
- Reivindicaciones 6-9: El ácido 3-[4-(2-hidroxibenzo[b][1,4]benzoxazepin-6-il)piperazin-1-il]-2,2-dimetilpropanoico y sus sales farmacéuticamente aceptables.
- Reivindicación 10: Composiciones que lo contienen.

►El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de compuestos útiles como moduladores de los desordenes del sueño.

►Para solucionar este problema técnico ahora la solicitud en estudio proporciona una composición que contiene derivados del ácido 3-[4-(benzo[b][1,4]benzoxazepin-6-il)piperazin-1-il]-2,2-dimetilpropanoico y sus sales farmacéuticamente aceptables ó composiciones que contienen ácido 3-[4-(2-hidroxibenzo[b][1,4]benzoxazepin-6-il)piperazin-1-il]-2,2-dimetilpropanoico y sus sales farmacéuticamente aceptables.

## 2. Determinación del Estado de la Técnica

Considerando la fecha de prioridad reclamada de la presente solicitud de patente 21/sept/2004, se realizo la búsqueda del estado de la técnica, en bases de datos donde ésta oficina tiene acceso libre, para búsquedas de documentos relacionados con la materia que se reclama como nueva e inventiva en la presente solicitud.

Encontrándose los siguientes documentos relevantes:

| N° | Documento   | Título                                                                        | Fecha de Publicación* |
|----|-------------|-------------------------------------------------------------------------------|-----------------------|
| D1 | US3.546.226 | 11-basic-substituted dibenzoxapines                                           | 08/dic/1970           |
| D2 | US5.344.828 | Piperazinealkanoic acid and a pharmaceutical composition comprising the same. | 06/sep/1994           |
| D3 | WO200406182 | Pesticidal dibenzo(hetero)azepine                                             | 08/jul/2004           |

|                |                                                  |       |             |
|----------------|--------------------------------------------------|-------|-------------|
|                | derivatives                                      |       |             |
| D4 US3.845.074 | Dibenzo[b,f]thiazepine[1,4]-yl<br>alcanoic acids | amino | 29/oct/1974 |

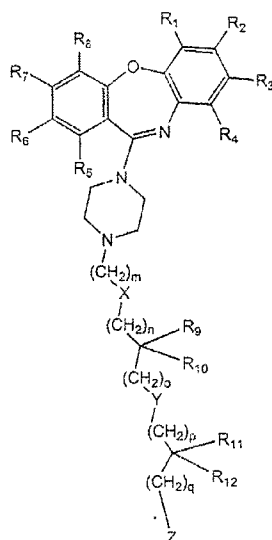
### 3. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486 de la C.A.N.)

#### 3.1. Novedad (artículo 16 D486 de la C.A.N.)

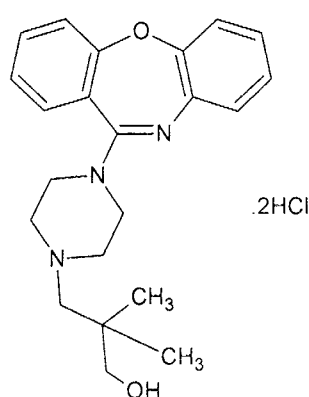
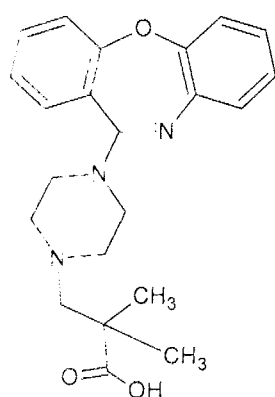
### 4. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486 de la C.A.N.)

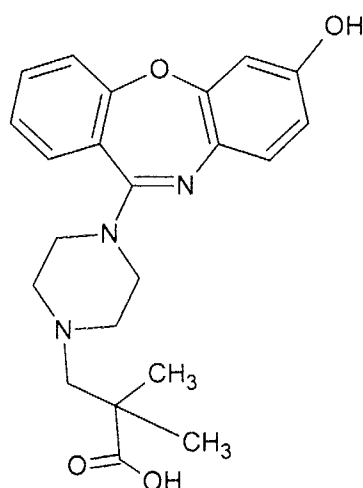
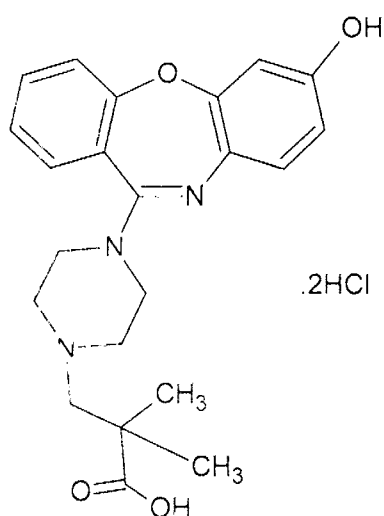
#### 4.1. Novedad (artículo 16 D486 de la C.A.N.)

El objeto de la solicitud son los derivados de 11-(piperazin-1-il)dibenzo[b,f][1,4]oxazepina de fórmula Markush (I):



Ahora después del examen de patentabilidad donde se objeto por novedad y obviamente se indicó que una solicitud con esas insolvencias no podía ostentar nivel inventivo; entonces ahora se reclama:





Ácido 3-[4-(benzo[b][1,4]benzoxazepin-6-il)piperazin-1-il]-2,2-dimetilpropanoico y ácido 3-[4-(2-hidroxibenzo[b][1,4]benzoxazepin-6-il)piperazin-1-il]-2,2-dimetilpropanoico sus sales farmacéuticamente aceptables sus sales farmacéuticamente aceptables.

Realizando nuevamente el análisis de las anterioridades D1-D4 ya no sobre el modelismo molecular obtenido mediante ordenador, de los compuestos de fórmula Markush (I); ahora sobre los compuestos ácido 3-[4-(2-hidroxibenzo[b][1,4]benzoxazepin-6-il)piperazin-1-il]-2,2-dimetilpropanoico junto con sus sales y ácido 3-[4-(2-hidroxibenzo[b][1,4]benzoxazepin-6-il)piperazin-1-il]-2,2-dimetilpropanoico y sus sales, que fue la materia que se presenta en el capítulo reivindicatorio después de ser restringido.

Las anterioridades citadas D1-D4, son referentes a 11-(piperazin-1-il)dibenzo[b,f][1,4]oxazepina, e igualmente comprenden el derivado -OH en la posición 3 del núcleo en referencia, de la misma manera comprenden una sustitución alquil-carboxílico sobre el N libre del anillo piperazínico, pero no aparece que esa sustitución sea -2,2-dimetilpropanoico, por lo tanto la materia así reclamada cumple con lo exigido en el artículo 16 D486 de la C.A.N.

#### 4.2. Nivel inventivo (artículo 18 D486 de la C.A.N.)

Tal como se indicó D1-D4, son referentes a 11-(piperazin-1-il)dibenzo[b,f][1,4]oxazepina, e igualmente comprenden el derivado -OH por en la posición 3 del núcleo en referencia, de la misma manera comprenden una sustitución alquil-carboxílico sobre el N libre del anillo piperazínico, pero no aparece que esa sustitución sea -2,2-dimetilpropanoico; ahora el capítulo reivindicatorio está limitado a que la cadena sea -2,2-dimetilpropanoico donde se sustenta ahora la patentabilidad de la presente solicitud y no existe una evidencia en las anterioridades que indique esa sustitución específica sobre el N libre del anillo piperazínico; de manera que para una persona versada en la materia no sería obvio derivar de manera evidente del estado de la técnica la materia objeto de la presente solicitud, por lo tanto se considera que la solicitud cumple con lo exigido en el artículo 18 D486 de la C.A.N.

#### 4.3 Aplicación industrial (artículo 18 D 486 de la C.A.N.)

Los compuestos derivados de N-[2,4-disustituido-6-(morfolin/tiomorfolin-4-il)piridin-3-il]carboxamida-sustituida y derivados de sustituido-[2,4-disustituido-6-(morfolin/tiomorfolin-4-il)piridin-3-il]carbamato cubiertos bajo la fórmula Markush (I), son susceptibles de ser sintetizados por los métodos de síntesis descritos en la presente solicitud, en las cantidades requeridas por la industria farmacéutica, para producir medicamentos, por lo tanto se considera que la solicitud cumple con lo exigido en el artículo 18 D 486 de la C.A.N.

► En consecuencia y por todo lo expuesto anteriormente, se recomienda **Conceder** el privilegio solicitado para las reivindicaciones 1-10, folios 557- 558.

► De acuerdo con la materia descrita y concedida el título debe ser:

ÁCIDO 3-[4-(BENZO[B][1,4]BENZOXAZEPIN-6-IL)PIPERAZIN-1-IL]-2,2-DIMETILPROPANOICO, ÁCIDO 3-[4-(2-HIDROXIBENZO[B][1,4]BENZOXAZEPIN-6-IL)PIPERAZIN-1-IL]-2,2-DIMETILPROPANOICO Y SALES FARMACEUTICAMENTE ACEPTABLES.

Bogotá, D. C., 22 de julio de 2011

|                     |                                  |
|---------------------|----------------------------------|
| CONCEPTO TECNICO N° | EXAMINADOR TECNICO Cód. N°202012 |
|---------------------|----------------------------------|

Revisado por: Consuelo Leguizamón L. 