

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES**

2020
Bogotá, D.C.,

Abogada
ALICIA LLOREDA RICAURTE
notificacionespatentes@lloredacamacho.com

ASUNTO	Radicación	09 054 436
	Trámite	011
	Evento	378
	Actuación	519
	Oficio	8 - 185 2 4
	Folios	8

Patente de Invención



Patente de Modelo de Utilidad

Vía Nacional

Vía PCT (Fase Nacional)



Capítulo I



Capítulo II

No. Solicitud Internacional

PCT/GB2007/004859

Fecha de Presentación Internacional

19/Diciembre/2007

Como resultado del examen de fondo realizado, con fundamento en el Artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se comunica:

1. Documentos estudiados

Descripción:	Folios 22 a 170	27/Mayo/2009
Reivindicaciones:	Folios 171 a 185	27/Mayo/2009
	Folios 193 a 206	15/Octubre/2009
Prioridad:	US 60 870 956	20/Diciembre/2006

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

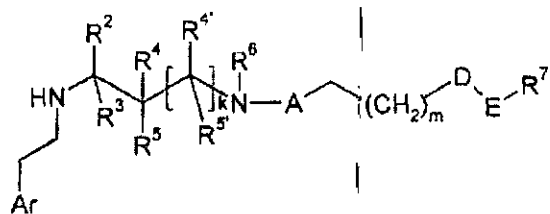
Título de la solicitud: "Derivados de amina y su uso en enfermedades mediadas por el adrenoceptor beta 2".

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar nuevos fármacos agonistas beta 2 de larga duración (LABA) que además puedan ser administrados una vez al día para el tratamiento de enfermedad pulmonar

Expediente 09 054 436 1er Art 45

obstructiva crónica (COPD) para evitar los efectos secundarios de los antimuscarínicos tal como el tiotropio.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona compuestos de la fórmula (I) los cuales pueden ser usados para el tratamiento de enfermedades mediadas por el adrenoreceptor beta 2.



El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K31/4704; A61K31/536; A61P11/00; A61P29/00; C07C233/01; C07C237/08; C07C237/10; C07D209/34; C07D215/227; C07D265/36.

4. De la Solicitud de Patente

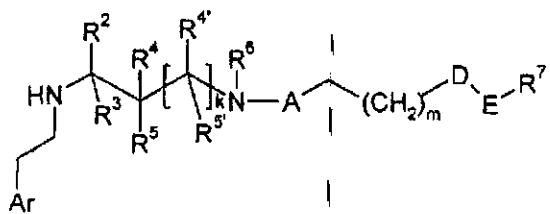
Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

El capítulo reivindicatorio presentado carece de claridad y concisión por cuánto:

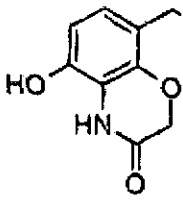
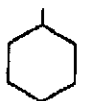
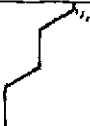
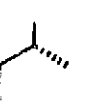
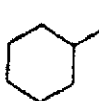
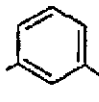
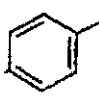
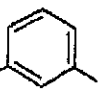
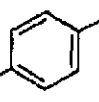
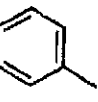
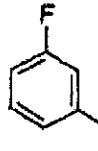
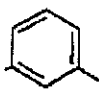
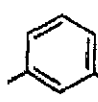
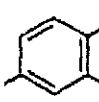
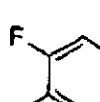
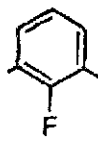
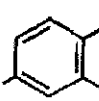
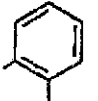
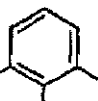
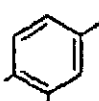
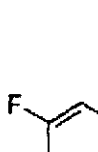
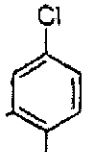
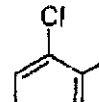
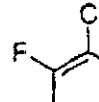
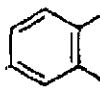
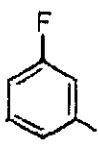
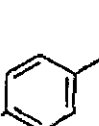
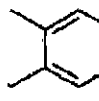
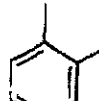
Deben eliminarse de las reivindicaciones los términos ambiguos que no permiten definir la invención ni que pueda ser reproducida por el experto en la materia. Se deben eliminar las expresiones: "sales farmacéuticamente aceptables", "adyuvante, diluyente o portador farmacéuticamente aceptables", "uno o más agentes".

Las reivindicaciones 1-19 no están debidamente sustentadas en la descripción porque de las definiciones de Ar, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R^{4'}, R^{5'}, k, m, D, E y R⁷, se obtiene un gran número de compuestos, muchos de los cuales no están ilustrados en la forma de ejemplos de la invención dentro del capítulo descriptivo.

Los ejemplos mencionan compuestos específicos en los cuales:

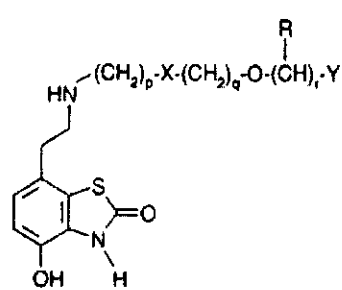


RADICAL	COMPUESTOS			
Ar				

	
R^2, R^3, R^4 R^5, R^4, R^5	H
k=	0
m=	1
R^6	-(CH₂)₃-CH₃, , , , , , , , , , , 
A	CO
D	O, NH,
E	-CH ₂ -CH ₂ -, CH ₂ -CH ₂ (CH ₃)-,
R7	Fenilo, , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , 

8° Un proceso para la preparación de compuestos de fórmula XX (Reivindicación 14).

El concepto común inventivo que comparten los compuestos de los grupos 1 a 4 ya era conocido previamente mediante el documento D1: WO97/10227, el cual divulga compuestos de fórmula



Dichos compuestos son agonistas del adrenoreceptor beta 2 y son usados para el tratamiento de enfermedades de las vías respiratorias y difieren de los compuestos de los diferentes grupos inventivos por la definición del grupo Ar, el cual en este caso es un anillo de benzotiazol.

En cuanto a los compuestos de los grupos inventivos 5 y 6, esta Oficina considera que si bien, son intermediarios en la síntesis de los compuestos de fórmula I, no comparten características estructurales con los compuestos finales de fórmula I, y por lo tanto no hacen parte de un concepto único inventivo.

Se sugiere presentar las solicitudes divisionales que considere necesarias, según los grupos mencionados o los considerados por el solicitante, ó limitar la solicitud inicial a una sola invención, eliminando de ella las otras invenciones.

El presente examen se llevará a cabo sobre los grupos inventivos 1, 3 y 4.

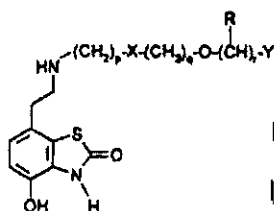
6. Determinación del Estado de la Técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de prioridad: diciembre 20 de 2006, y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO9710227A1	Benzothiazolone Derivatives	20/Marzo/1997
D2	US2653977A	Bis-(substituted phenylalkylamino) compounds.	29/Septiembre/1953
D3	US4914126A	Aromatic amines	03/Abril/1990
D4	US5648370A	7-(2-aminoethyl) benzothiazolones	15/07/1997
D5	Drugs of the future, vol 30, (12), págs. 1219, 2005.	Indacaterol	2005
D6	WO2004016578A2	MEDICINAL COMPOUNDS	26/Febrero/2004

D1

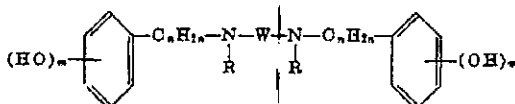
http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=9710227A1&KC=A1&FT=D&ND=4&date=19970320&DB=EPODOC&locale=en_EP



Divulga compuestos de fórmula

D2

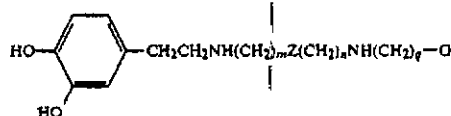
http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=&CC=US&NR=2653977A&KC=A



Divulga compuestos de fórmula

D3

http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=19900403&CC=US&NR=4914126A&KC=A



Divulga compuestos de fórmula

D4

http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=US&NR=5648370A&KC=A&FT=D&ND=3&date=19970715&DB=EPODOC&locale=en_EP

Divulga compuestos de fórmula $Ar-CH_2CH_2-NH-CR^1R^2-X-Y$

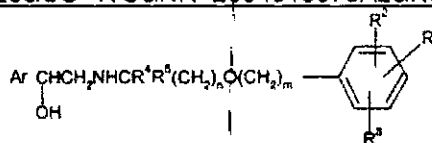
D5

http://journals.prous.com/journals/servlet/xmlxsl/pk_journals.xml_summary_pr?p_JournalId=2&p_RefId=955084&p_IsPs=N

Divulga un compuesto denominado Indacaterol el cual es un agonista del adrenoceptor beta 2.

D6

http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20040226&CC=WO&NR=2004016578A2&KC=A2



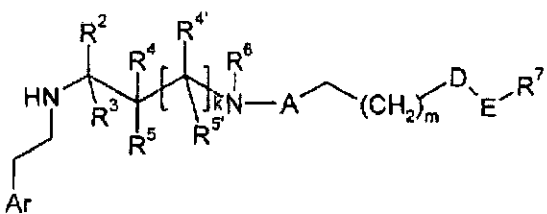
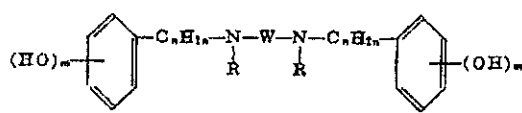
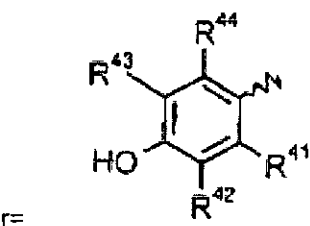
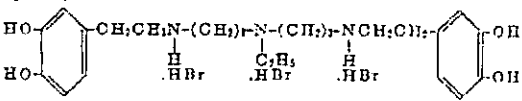
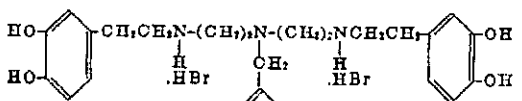
Divulga compuestos de fórmula

7. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

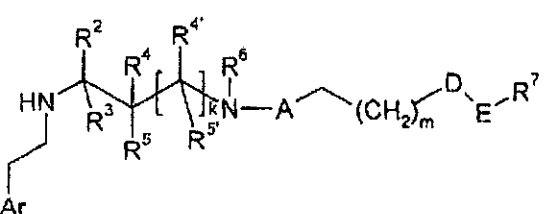
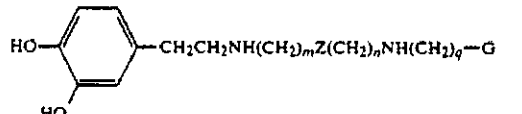
Novedad (Art 16 D486)

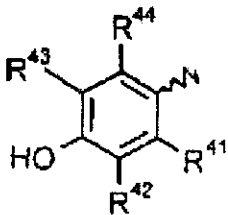
La reivindicación 1 consiste en un compuesto de la fórmula I con las siguientes características técnicas:

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica (D2):

Características esenciales	D2
Compuesto de fórmula I:	Compuesto de fórmula:
	
Donde: R2, R3, R4, R5, R4', R5'= H R6=-(X)p-Y-(Z)q-R10; p, q= 1; X=CH2, Y= enlace; Z=-CH2-; R10= H. R7= fenilo sustituido en posiciones meta y para con grupos hidroxilo. A= CH2 D=NR8; R8= H E= CR ⁶³ R ⁶⁴ CR ⁶⁵ R ⁶⁶ ; R63 a R66= H. m=1 k=1	Donde: m= 2 o 3. n= entero de 1 a 6. R= seleccionado de H y alquilo inferior. W= alquilenos de no más de 14 carbonos.
 Ar= R41, R42 y R44= H R43= OH	Ejemplos:  

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica (D3):

Características esenciales	D3
Compuesto de fórmula I:	Compuesto de fórmula:
	
Donde: R2, R3, R4, R5=H	Donde: Z= NR; R=H o alquilo de C1-6

R4', R5'= cuando están presentes son ambos H. R6=-(X)p-Y-(Z)q-R10; p, q=0 o 1; Y= enlace; cuando p=1 entonces X=grupo alquileo, cuando q=1 Z= grupo alquileo; R10= H. R7= anillo aromático o heteroaromático de 5 a 14 miembros, opcionalmente sustituido con fenilo, halógeno, CF3 o alcoxi C1-6. A= CH2 D=NR8; R8= H E= CR⁶³R⁶⁴ o CR⁶³R⁶⁴CR⁶⁵R⁶⁶ o CR⁶³R⁶⁴CR⁶⁵R⁶⁶CR⁶⁷R⁶⁸; R63 a R68= H. m=0 a 2 k= 0 o 1.  Ar= R41, R42 y R44= H R43= OH	m= entero de 2 a 3. n= entero de 2 a 4. q= entero de 1 a 3. G= carbociclo saturado o insaturado, mono bíclico o heterociclo, los cuales pueden estar opcionalmente sustituidos por trihalometilo, fenilo, alcoxi C1-6 o halógeno.
---	---

Las características **esenciales** del compuesto de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente de forma independiente en los documentos D2 o D3, los cuales revelan compuestos con las características que se muestran en el cuadro anterior, las cuales se traslapan con la de la presente invención.

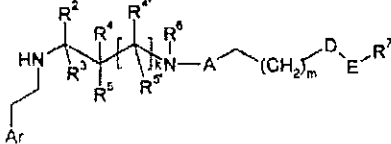
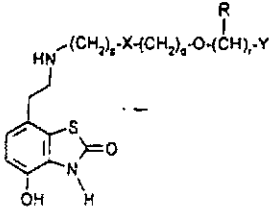
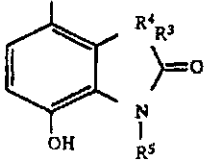
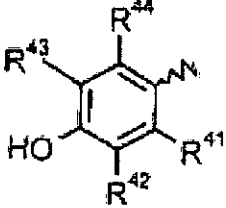
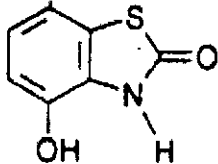
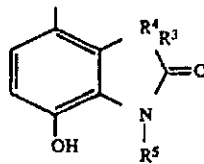
En consecuencia, la reivindicación 1 no es nueva según lo divulgado en los documentos D2 o D3.

Las reivindicaciones dependientes 2 a 12 se considera que no son nuevas.

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en un compuesto de la fórmula I con las siguientes características técnicas:

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica (D1 y D4) para el grupo inventivo 1°:

Características esenciales	D1	D4
Compuesto de fórmula I: 	Compuesto de fórmula: 	Compuesto de fórmula: $Ar-CH_2CH_2-NH-CR^1R^2-X-Y$ Donde Ar: 
Donde: R2, R3, R4, R5, R4', R5'= H R6=-(X)p-Y-(Z)q-R10; p, q= 0; Y= enlace; R10= H. R7= anillo aromático o heteroaromático de 5 a 14 miembros, opcionalmente sustituido con fenilo, halógeno, o alquilo C1-6. A= SO2 D= O E= CR ⁶³ R ⁶⁴ CR ⁶⁵ R ⁶⁶ o CR ⁶³ R ⁶⁴ CR ⁶⁵ R ⁶⁶ CR ⁶⁷ R ⁶⁸ ; R63 a R68= H. m= 1 o 2. k=1	Donde: p= 3 X= -NHSO2- q= 2 o 3 r= 2 o 3 R=H Y= tienilo opcionalmente sustituido por alquilo o halógeno, o fenilitio o fenilo opcionalmente sustituido por alquilo o halógeno.	Donde: R1 y R2= H o alquilo C 1 a 6. X=o, NR8; R8=H Y= grupo arilo o cicloalquilo opcionalmente sustituido.
 Ar= R41, R42 y R44= H R43= OH		

Los documentos D1 y D4 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulgan compuestos con las características técnicas que se pueden observar en la tabla anterior, algunas de las cuales se traslapan con las de la invención.

La diferencia entre los compuestos definidos en la reivindicación 1 y los de D1 consiste en la definición de Ar, es decir en el presente caso la presencia de un fenol en lugar de un benzotiazol, conservando el resto de la molécula.

No se observa un efecto inesperado como consecuencia de la diferencia anterior.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo modificar el los compuestos conocidos en D1 para (conseguir compuestos alternativos para el tratamiento de enfermedades como el asma y la COPD".

Sin embargo, en el estado de la técnica se encuentran divulgados compuestos que conservan la misma actividad biológica aun cuando dicho sustituyente Ar cambie, como el compuesto divulgado en D4 en donde Ar puede ser un anillo 4-hidroxibenceno.

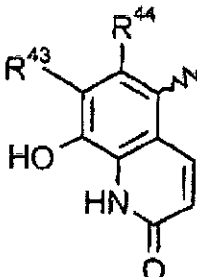
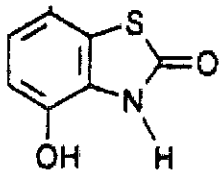
En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia estaría motivada a realizar cualquier cambio en el anillo Ar, siempre y cuando se conserve el resto de la molécula que en este caso se considera como el grupo farmacofórico, con la expectativa razonable de conservar la misma actividad biológica para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Conclusión:

La reivindicación 1 no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18). Las reivindicaciones dependientes 2 a 12 y 17 a¹19 no tienen características técnicas adicionales por lo tanto se considera que no son inventivas.

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica (D1 y D5) para el grupo inventivo 3°:

Características esenciales	D1	D5
Compuesto de fórmula I:	Compuesto de fórmula:	Compuesto agonista de adrenoreceptor beta de fórmula:
Donde: R2, R3, R4, R5, R4', R5' = H	Donde:	
R6 = -(X)p-Y-(Z)q-R10; p, q = 0; Y = enlace; R10 = H.	p = 3	
	X = -NHSO2-	
R7 = anillo aromático o heteroaromático de 5 a 14 miembros, opcionalmente sustituido con fenilo, halógeno, o alquilo C1-6.	q = 2 o 3	
	r = 2 o 3	
	R = H	

A= SO₂ D= O E= CR⁶³R⁶⁴CR⁶⁵R⁶⁶o CR⁶³R⁶⁴CR⁶⁵R⁶⁶CR⁶⁷R⁶⁸; R63 a R68= H. m= 1 o 2. k=1	Y= tienilo opcionalmente sustituido por alquilo o halógeno, o feniltio o fenilo opcionalmente sustituido por alquilo o halógeno.	
Ar=  R41, R42 y R44= H R43= OH		

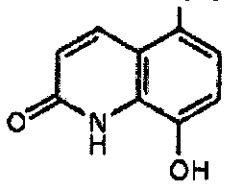
Los documentos D1 y D5 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulgan compuestos con las características técnicas que se pueden observar en la tabla anterior, algunas de las cuales se traslapan con las de la invención.

La diferencia entre los compuestos definidos en la reivindicación 1 y los de D1 consiste en la definición de Ar, es decir en el presente caso la presencia de un fenol en lugar de un benzotiazol, conservando el resto de la molécula.

No se observa un efecto inesperado como consecuencia de la diferencia anterior.

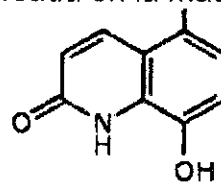
Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo modificar el los compuestos conocidos en D1 para (conseguir compuestos alternativos para el tratamiento de enfermedades como el asma y la COPD".

Sin embargo, en el estado de la técnica se encuentran divulgados compuestos que conservan la misma actividad biológica aun cuando dicho sustituyente Ar cambie, y también en el documento D5 se divulgan compuesto con la misma actividad y el



mismo resto Ar

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia estaría



motivada a realizar un cambio en el anillo Ar, de D1 por siempre y

cuando se conserve el resto de la molécula que en este caso se considera como el grupo farmacofórico, con la expectativa razonable de conservar la misma actividad biológica para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

La reivindicación 1 consiste en un compuesto de la fórmula I con las siguientes características técnicas:

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica (D1 y D6) para el grupo inventivo 4°:

Características esenciales	D1	D6
Compuesto de fórmula I:	Compuesto de fórmula:	Compuesto agonista de adrenoreceptor beta de fórmula:
Donde: R2, R3, R4, R5, R4', R5'= H R6=-(X)p-Y-(Z)q-R10: p, q= 0; Y= enlace; R10= H.	Donde: p= 3	Ar: puede ser un resto del grupo a y b que pueden ser seleccionados de varios incluyendo:
R7= anillo aromático o heteroaromático de 5 a 14 miembros, opcionalmente sustituido con fenilo, halógeno, o alquilo C1-6. A= SO2 D= O E= CR ⁶³ R ⁶⁴ CR ⁶⁵ R ⁶⁶ o CR ⁶³ R ⁶⁴ CR ⁶⁵ R ⁶⁶ CR ⁶⁷ R ⁶⁸ ; R63 a R68= H. m= 1 o 2. k=1	X= -NHSO2- q= 2 o 3 r= 2 o 3 R=H Y= tienilo opcionalmente sustituido por alquilo o halógeno, o fenilto o fenilo opcionalmente sustituido por alquilo o halógeno.	
		(xvi)

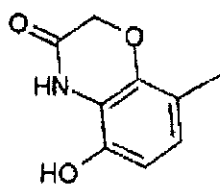
Los documentos D1 y D6 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulgan compuestos con las características técnicas que se pueden observar en la tabla anterior, algunas de las cuales se traslapan con las de la invención.

La diferencia entre los compuestos definidos en la reivindicación 1 y los de D1 consiste en la definición de Ar, es decir en el presente caso la presencia de un fenol en lugar de un benzotiazol, conservando el resto de la molécula.

No se observa un efecto inesperado como consecuencia de la diferencia anterior.

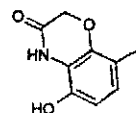
Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo modificar el los compuestos conocidos en D1 para (conseguir compuestos alternativos para el tratamiento de enfermedades como el asma y la COPD".

Sin embargo, en el estado de la técnica se encuentran divulgados compuestos que conservan la misma actividad biológica aun cuando dicho sustituyente Ar cambie, y también en el documento D6 se divulgan compuesto con la misma actividad y el



mismo resto Ar (xvi)

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia estaría



motivada a realizar un cambio en el anillo Ar, de D1 por (xvi) siempre y cuando se conserve el resto de la molécula que en este caso se considera como el grupo farmacofórico, con la expectativa razonable de conservar la misma actividad biológica para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Conclusión:

La reivindicación 1 no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18). Las reivindicaciones dependientes 2 a 12 y 17 a 19 no tienen características técnicas adicionales por lo tanto se considera que no son inventivas.

8. Conclusión

Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud están afectados así:

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO9710227A1	1 a 12 y 17 a 19	Nivel Inventivo
D2	US2653977A	1 a 12	Novedad
D3	US4914126A	1 a 12	Novedad
D4	US5648370A	1 a 12 y 17 a 19	Nivel Inventivo
D5	Drugs of the future, vol 30, (12), págs. 1219, 2005.	1 a 12 y 17 a 19	Nivel Inventivo
D6	WO2004016578A2	1 a 12 y 17 a 19	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 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.

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 23 OCT. 2012

Realizado por: Ximena Andrade. *XIA*
Revisado por: Consuelo Leguizamón. *CL*
Aprobado: José Luis Salazar López.



JOURNALS ON THE WEB

Quick Search in all journals

Prous.com Journals Home Drugs of the Future on the Web Drugs of the Future Information My Profile Contact Us

Drugs of the Future

Drugs Fut 2005, 30(12): 1219
ISSN 0377-8282
Copyright 2005 Prous Science
CCC: 0377-8282
DOI: 10.1358/dof.2005.030.12.955084

Indacaterol
Davies, S.L., Castaner, J.

The chronic inflammatory syndromes asthma and chronic obstructive pulmonary disease (COPD) are significant causes of morbidity, mortality, increased healthcare costs and hospital admissions. beta2-Adrenoceptor agonists are among the first-line therapies for asthma and COPD due to their bronchodilating effects, but currently available therapeutics are associated with a short duration of action and a broad side effect profile. Indacaterol (QAB-149) is currently undergoing phase II development for the treatment of asthma and COPD. Clinical studies have demonstrated that it is well tolerated and associated with improved cardiovascular safety in both patient populations. Furthermore, it is the first beta2-adrenoceptor agonist to provide rapid improvements in bronchodilatory control and FEV1, with a sustained (24 h) duration of action. Indacaterol could therefore provide substantial improvement in the life-threatening symptoms of breathlessness and bronchoconstriction associated with asthma and COPD.

Full Text: HTML, PDF

Copyright © Thomson Reuters or its licensors. All rights reserved.
Legal Information.

Register or sign in

User Name



Alert me to new issues