

LLOREDA CAMACHO & CO.

ABOGADOS

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 6069700 Fax 6069701

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 13-205178- -00003-0000

Fecha: 2014-12-30 16:02:19 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 523 RESPUESTA Folios: 5

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

Trámite: 11
Evento: 378
Actuación: 523

Re: PI.-JANSSEN PHARMACEUTICA NV. -Solicitud de Patente de Invención en Fase Nacional PCT para "COMPUESTOS DERIVADOS DE 6,7-DIHIDROPIRAZOLO[1,5-a]PIRAZIN-4-ILAMINA CON ACTIVIDAD INHIBITORIA DE BETA-SECRETASA (BACE)".-Clase C07D 487/04.-Expediente número 13-205.178.

1. Me refiero al auto dictado por ese Despacho notificado por fijación en lista de 7 de octubre de 2014.

2. Con el fin de responder las objeciones expuestas por el Señor Examinador en su Concepto Técnico correspondiente al Oficio No. **12635**, en relación con el Título de la solicitud, la Claridad del Capítulo Reivindicatorio, la Excepción a la Patentabilidad y las Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso de la presente solicitud, me permito dirigir su atención a las siguientes modificaciones y argumentos técnicos por medio de los cuales no sólo se superan completamente dichas objeciones sino que además se establece de manera incontrovertible la patentabilidad de la solicitud en estudio.

3. **TÍTULO DE LA SOLICITUD**

En primer lugar y en conexión con el título de la solicitud, el Señor Examinador indica que el título no corresponde con el objeto de la solicitud ya que hace referencia al uso de los compuestos. De esta forma, sugiere hacer las correcciones pertinentes.

Tomando en consideración esta objeción, me permito manifestar que es deseo del solicitante modificar el título de la solicitud. De esta forma, el nuevo título se lee como sigue:

"COMPUESTOS DERIVADOS DE 6,7-DIHIDROPIRAZOLO[1,5-a]PIRAZIN-4-ILAMINA CON ACTIVIDAD INHIBITORIA DE BETA-SECRETASA (BACE)"

Sobre este particular me permito resaltar que este nuevo título refleja de manera clara el objeto de la invención, eliminando la referencia objetada. Por consiguiente, el nuevo título supera completamente la objeción presentada por el Señor Examinador a este respecto.

4. CAPÍTULO REIVINDICATORIO.

4.1. Claridad del Capítulo Reivindicatorio.

Ahora bien, con respecto a la claridad del capítulo reivindicatorio, el señor Examinador afirma lo siguiente:

- *"La reivindicación 1 no es clara ni concisa cuando menciona que los sustituyentes $X^1 - X^4$ causan que el núcleo farmacofórico contenga diversas estructuras, impidiendo el reconocimiento de los compuestos de interés a proteger. De esta forma, se pueden presentar múltiples opciones de posibles compuestos, en donde el núcleo farmacofórico podría contener diversos anillos. En el caso de los términos heteroarilo y heterocíclico, no se mencionan qué tipo de heteroátomos o heterátomo hace parte de tales estructuras ni la cantidad de los mismos. Con lo anterior, se obtienen un número indefinido de compuestos que no encuentran soporte en la descripción. Se sugiere a la solicitante restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que han sido sintetizados o probados, es decir, que se encuentran debidamente sustentados en la descripción (...)"*.

Respecto al anterior señalamiento, me permito indicar que la reivindicación 1 ha sido modificada y restringida en su contenido de la siguiente manera:

- ✓ Se ha dividido la descripción de los sustituyentes R^1 y R^2 en dos enunciados independientes. Adicionalmente, se han eliminado los términos "mono-" y "cicloalquilo C_{3-6} ".
- ✓ Se han eliminado los términos "hidrógeno", "cicloalquilo C_{3-6} ", "mono-", "homoarilo" y "heteroarilo" del grupo de compuestos que corresponden al sustituyente R^3 .
- ✓ Se ha separado la descripción del sustituyente X^1 de la descripción de los sustituyentes X^2 , X^3 y X^4 . Adicionalmente, se ha limitado la definición del sustituyente X^1 a $C(R^4)$, en donde R^4 es hidrógeno o halo, y adicionalmente se ha limitado la definición de X^2 , X^3 y X^4 a únicamente $C(R^4)$, en donde R^4 es hidrógeno.

LLOREDA CAMACHO & CO.

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 6069700 Fax 6069701

- ✓ Se ha limitado la definición del sustituyente L a $-N(R^5)CO-$, donde R^5 es solamente hidrógeno.
- ✓ Se ha definido Ar solamente como heteroarilo, eliminando la definición y descripción de los compuestos correspondientes al homoarilo.
- ✓ Finalmente, se han eliminado del grupo de selección de compuestos heteroarilo los términos "pirimidilo", "piridazilo", "furanilo", "tienilo", "pirrolilo", "imidazolilo", "triazolilo", "tiazolilo", "tiadiazolilo" y "oxadiazolilo". Adicionalmente, se han eliminado los términos "mono-", "polihalo(alquiloxi C_{1-3})" y "solvato" del grupo de sustituyentes para cada tipo de heteroarilo.

A la luz de lo anterior, es evidente que la nueva reivindicación 1 permite restringir la generalización del tipo de compuestos que han sido sintetizados, y define de manera clara y concisa los sustituyentes del compuesto de fórmula (I).

- *"La reivindicación 6 no es clara ya que un proceso de preparación siempre debe estar definido por las etapas que lo caracterizan, los reactivos intervinientes y además las características técnicas esenciales que lo diferencien de los ya conocidos en el estado de arte. Se sugiere realizar las aclaraciones necesarias o eliminarla del pliego reivindicatorio si no se considera necesaria".*

En relación a lo anterior, amablemente me permito señalar que la reivindicación 6 de la solicitud actualmente presentada ha sido eliminada.

4.2. Modificaciones al Capítulo Reivindicatorio

Teniendo en cuenta las objeciones de claridad, me permito manifestar que es deseo del solicitante presentar un **capítulo reivindicatorio modificado**, que reemplaza al actualmente presentado, con el propósito de clarificar los objetos de las reclamaciones presentadas como parte del concepto técnico realizado por ese Despacho.

Respecto a las modificaciones realizadas, me permito resaltar que no implican de ninguna manera una ampliación al alcance de la solicitud, tal como fue originalmente presentada, toda vez que el capítulo reivindicatorio modificado define los derivados de 6,7-dihidropirazolo[1,5-a]pirazin-4-ilamina novedosos con actividad inhibitoria de la enzima beta-secretasa (BASE) y sus respectivas composiciones farmacéuticas, los cuales son el objeto de la presente invención de acuerdo con las enseñanzas de la descripción. Dichas modificaciones se exponen a continuación:

- **Nueva Reivindicación 1:** tiene como base la reivindicación 1 actualmente presentada, y ha sido modificada para limitar su alcance. Dicha modificación es descrita en el numeral 4. 1 del presente memorial.
- **Nueva Reivindicación 2:** tiene como base la reivindicación 2 actualmente presentada, y ha sido modificada para limitar su alcance. Al ser una reivindicación dependiente de la reivindicación 1, dicha modificación presenta las mismas restricciones descritas en el numeral 4.1 del presente memorial.
- **Nueva Reivindicación 3:** tiene como base la reivindicación 3 actualmente presentada, y ha sido modificada para limitar su alcance. Al ser una reivindicación dependiente de la reivindicación 1, dicha modificación presenta las mismas restricciones descritas en el numeral 4.1 del presente memorial.
- **Nuevas Reivindicaciones 4 y 5:** corresponden a las reivindicaciones 4 y 5 de la solicitud actualmente presentada.

Me permito señalar que las reivindicaciones **6, 7 y 8** del Capítulo Reivindicatorio de la solicitud original fueron **eliminadas** del documento modificado.

De esta forma, **el capítulo reivindicatorio modificado está constituido por 5 reivindicaciones**, las cuales se refieren de manera más clara y concisa a las características técnicas esenciales de los compuestos derivados de formula (I) que son objeto de la presente solicitud, y que cuentan con pleno sustento en las enseñanzas de la descripción.

En vista de todo lo discutido anteriormente, me permito resaltar que el nuevo capítulo reivindicatorio es totalmente claro y conciso al reclamar compuestos derivados de 6,7-dihidropirazolo[1,5-a]pirazin-4-ilamina con actividad inhibitoria de beta-secretasa (BACE). Asimismo, dicho capítulo modificado supera completamente las objeciones de claridad presentadas por el Señor Examinador y, por lo tanto, cumple a cabalidad con lo estipulado por el Artículo 30 de la Decisión Andina 486 de 2000.

5. **EXCEPCIONES A LA PATENTABILIDAD.**

Por otra parte, el Señor Examinador indica que la reivindicación 8 no sería patentable al referirse a un método de tratamiento, de acuerdo con el Artículo 20 de la Decisión 486/2000.

Sobre este particular, me permito señalar que tal y como se expuso en el numeral 4.2 del presente memorial, dicha reivindicación 8 ha sido eliminada y no hace parte del capítulo reivindicatorio modificado.

LLOREDA CAMACHO & CO.

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 6069700 Fax 6069701

En este sentido, me permito señalar que el mencionado capítulo reivindicatorio modificado se ajusta completamente a los requerimientos del Artículo 20 de la Decisión Andina 486 de 2000.

6. REIVINDICACIONES RELATIVAS A USOS O SEGUNDOS USOS.

En relación a esta objeción, el Señor Examinador establece que el uso de la reivindicación 7 no es patentable de acuerdo al Artículo 4 de la Decisión 486/2000.

Tomando en consideración la anterior objeción, me permito aclarar que de acuerdo con las modificaciones expuestas en el numeral 4.2 del presente memorial, la reivindicación 7 ha sido eliminada.

7. CONCLUSIÓN.

Para finalizar, me permito resaltar que el capítulo reivindicatorio modificado presentado junto con este memorial es totalmente claro y conciso al reclamar los compuestos derivados de 6,7-dihidropirazolo[1,5-a]pirazin-4-ilamina con actividad inhibitoria de beta-secretasa (BACE), sin hacer referencia a usos o métodos de tratamiento y cumpliendo así con lo exigido por la mencionada Decisión Andina 486 de 2000.

8. Anexo me permito presentar copia de las páginas **106** y **107** que corresponde al **capítulo reivindicatorio modificado**, tal como se discutió en el presente memorial, constituido por **5** reivindicaciones.

9. En vista de lo anterior, ruego a usted proceder a estudiar nuevamente la solicitud a la luz de las modificaciones y los argumentos presentados y conceder el privilegio de patente solicitado.

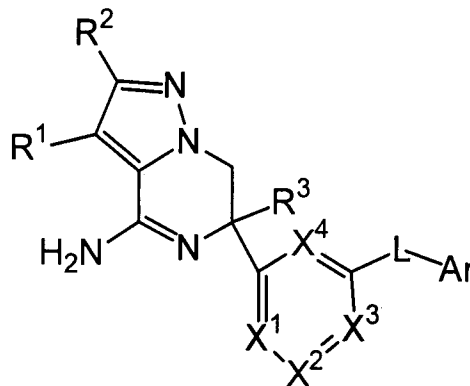
Señor Superintendente,


ALICIA LLOREDA RICAURTE

T.P. 53.215

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula (I)



o un tautómero o forma estereoisomérica de este, donde:

R^1 se selecciona del grupo constituido por hidrógeno y halo;

R^2 se selecciona del grupo constituido por hidrógeno, ciano, alquilo C_{1-3} y polihalo(alquilo C_{1-3});

R^3 se selecciona del grupo constituido por alquilo C_{1-3} y polihalo(alquilo C_{1-3});

X^1 es $C(R^4)$, donde R^4 es hidrógeno o halo;

X^2 , X^3 , X^4 son $C(R^4)$, donde R^4 es hidrógeno;

L es $-N(R^5)CO-$, donde R^5 es hidrógeno;

Ar es heteroarilo;

Heteroarilo se selecciona del grupo constituido por piridilo, sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados del grupo constituido por halo y ciano; oxazolilo no sustituido o sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados del grupo constituido por alquilo C_{1-3} o polihalo(alquilo C_{1-3}); pirazolilo, sustituido con polihalo(alquilo C_{1-3}); pirazilo, sustituido con alquilo C_{1-3} ; o una sal de adición de este.

2. El compuesto de la reivindicación 1, donde

R^1 y R^2 son hidrógeno;

Ar es heteroarilo;

Heteroarilo se selecciona del grupo constituido por piridilo sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados del grupo constituido por halo y ciano; y pirazilo sustituido con alquiloxi C_{1-3} ;

o una sal de adición de éste.

3. El compuesto de la reivindicación 1, donde

R^1 y R^2 son hidrógeno;

X^1 , X^2 , X^3 , X^4 son CH;

Ar es heteroarilo;

Heteroarilo es piridilo sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados del grupo constituido por cloro, fluoro y ciano;

o una sal de adición de este.

4. El compuesto de la reivindicación 1, donde el átomo de carbono sustituido con R^3 tiene la configuración *R*.

5. Una composición farmacéutica que comprende una cantidad terapéuticamente eficaz de un compuesto como el que se define en cualquiera de las reivindicaciones 1-4 y un portador farmacéuticamente aceptable.