

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° **8257** de **10 de julio de 2020**

Ref. Expediente N° NC2019/0002692

Señor(a)
F. HOFFMANN-LA ROCHE AG

TÍTULO DE LA SOLICITUD: **“NUEVOS DERIVADOS DE ISOXAZOLIL ÉTER COMO PAM DE GABA A ALFA5.”**

NÚMERO DE SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/EP2017/081768

FECHA DE PRESENTACIÓN INTERNACIONAL: 7 de diciembre de 2017.

PRIORIDAD(ES): EP 16202889.8 08 de diciembre de 2016.

Como resultado del examen de patentabilidad realizado a la solicitud indicada en la referencia, atendiendo a lo consagrado en el artículo 45 de la Decisión 486 de 2000, se le comunica que esta Dirección ha encontrado que la materia objeto de solicitud no cumple con algunos requisitos establecidos en la Decisión, con fundamento en los siguientes aspectos:

1. Modificaciones presentadas (Art. 34 Decisión 486)

Se aceptan las modificaciones radicadas el 4 de abril de 2019, bajo el número NC2019/0003358, por ajustarse a los requisitos legales.

2. Objeto de la invención

De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del Capítulo Primero del Título X de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, 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 al momento de realizar el examen de patentabilidad consagrado en el artículo 45 de la Decisión 486.

Por lo tanto, se estudiarán las reivindicaciones 1 a 10 del radicado N° NC2019/0003358 del 4 de abril de 2019.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar compuestos para la terapia o profilaxis en un mamífero, para el tratamiento de enfermedades relacionadas con los receptores de GABA_A α5 y enfermedades y afecciones que pueden tratarse mediante la modulación de la actividad de receptores de GABA_A α5, tales como la enfermedad de Alzheimer, deterioro cognitivo leve (MCI), deterioro cognitivo relacionado con la edad, síntomas negativos y/o cognitivos asociados con la esquizofrenia, trastornos bipolares, trastornos del espectro autista (ASD), síndrome de Angelman, síndrome de Rett, síndrome de Prader-Willi, epilepsia, trastorno de estrés postraumático (PTSD), esclerosis lateral amiotrófica (ELA), trastorno de X frágil.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona compuestos derivados de piridazinil-isoxazol éter como PAM de GABA_A α5.



Oficio N° 8257 de 10 de julio de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0002692

3. De la solicitud de patente

3.1. Título

El nombre de la invención de que se trata en el artículo 27 literal d) de la Decisión 486 deberá reflejar el objeto y el campo industrial con el cual se relaciona la misma y ser concordante con la materia descrita y las reivindicaciones de la solicitud. El nombre no podrá referirse a nombres personales, marcas de productos o nombres de fantasía.

El solicitante en el escrito radicado bajo el N° NC2019/0002692 el 26 de marzo de 2019, tituló la invención como: “NUEVOS DERIVADOS DE ISOXAZOLIL ÉTER COMO PAM DE GABA A ALFA5.”. Este título no se relaciona con el objeto de la solicitud contenido en la descripción y las reivindicaciones, por lo cual se sugiere el título siguiente: “DERIVADOS DE 3- PIRIDAZINIL-ISOXAZOL -METOXI- NICOTINAMIDA Y COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS QUE LOS COMPRENDEN”.

4. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 8 de diciembre de 2016 que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de prioridad.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2009071477	“Isoxazolo-pyridazine derivatives”	11 de junio de 2009
D2	WO2010112475	“Hydroxy-methyl isoxazole derivatives as gaba a modulators”	7 de octubre de 2010

El documento D1¹ divulga un compuesto de fórmula (I) derivados de isoxazol-piridazina, con afinidad y selectividad por el receptor GABA A alfa 5 para el tratamiento de enfermedades de tipo cognitivo tales como Alzheimer (Resumen, ejemplos, reivindicaciones).

El documento D2² divulga un derivado de hidroximetil-isoxazol como moduladores de GABA A alfa 5 (Resumen, ejemplos, reivindicaciones).

5. Examen de Patentabilidad (Art. 14 Decisión 486)

5.1. Nivel Inventivo (Art. 18 Decisión 486)

La reivindicación 1 consiste en: “*Compuestos de fórmula (I) (...)*” (Radicado N° NC2019/0003358 del 4 de abril de 2019).

¹http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2009071477A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20090611&DB=&locale=en_EP

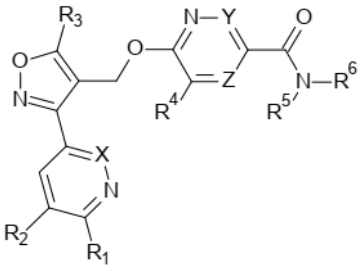
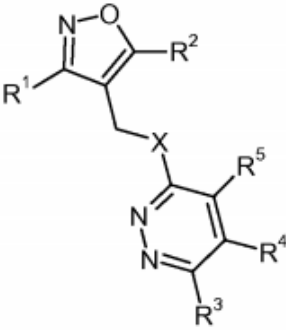
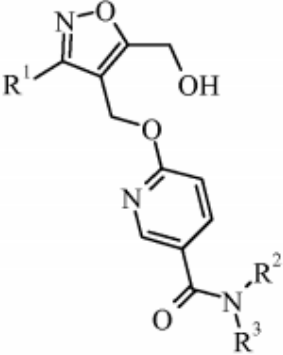
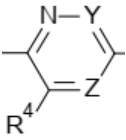
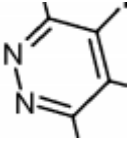
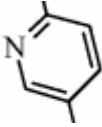
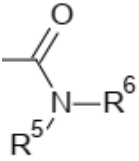
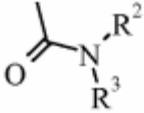
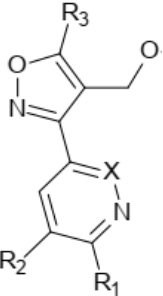
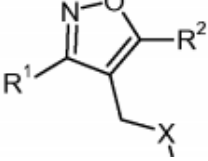
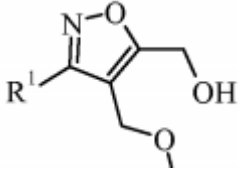
²http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2010112475A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20101007&DB=&locale=en_EP



Oficio N° 8257 de 10 de julio de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0002692

Tabla 1. Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D1	D2
Compuestos de fórmula (I): 	Compuestos de fórmula (I): 	Compuestos de fórmula (I): 
 R4= H, alquilo C1-6, alcoxi C1-6, cicloalquilo C3-8, halógeno Y = N y CR10 Z = N y CR11		
 R5= H R6= H, alquilo C1-6, cicloalquilo C3-8 sustituido con R7, R8, R9; cicloalquilo C3-8-alquilo C1-6 sustituido con R7, R8, R9; alquilsulfonil C1-6-alquilo C1-6; ciano-alquilo C1-6	-C(O)-NR ^d R ^e ,	 R2= H, alquilo inferior R3= alquilo, alquilo sustituido con halógeno, cicloalquilo, heterociclo (...)
 R1= alquilo C1-6, halo-alquilo C1-6, alcoxi C1-6, halo-alcoxi C1-6, hidroxialquilo C1-6, cicloalquilo C3-8, halógeno, amino sustituido en el átomo de nitrógeno con uno o dos sustituyentes seleccionados de : H, alquilo C1-6, cicloalquilo C3-8	 R1= fenil, piridinil, pirimidinil R2 = alquilo C1-4, H, haloalquilo C1-4 X= O o NH	 R1= alquilo, arilo, heteroarilo sustituido



Oficio N° 8257 de 10 de julio de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0002692

R2= H, halógeno		
R3= H, alquilo C1-6, cicloalquilo C3-8, hidroxi-alquilo C1-6, halo-alquilo C1-6		
X= N y CH		

El documento D1 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga un compuesto de fórmula (I) derivado de isoxazol-piridazina, con afinidad y selectividad por el receptor GABA A alfa 5 para el tratamiento de enfermedades de tipo cognitivo tales como Alzheimer (Resumen, ejemplos, reivindicaciones).

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1 y el compuesto divulgado de D1 consiste en un grupo piridin-3-ilo sustituido en la posición 5 del anillo oxazol.

El efecto que se logra al incluir un grupo piridin-3-ilo sustituido en la posición 5 del anillo oxazol es mejorar la afinidad de los compuestos hacia α5 de receptor de GABA_A y su eficacia en los ovocitos que sobreexpresan GABA_A α5.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿Cómo modificar los compuestos conocidos en D1 con el fin de mejorar su afinidad y eficacia hacia α5 de receptor de GABA_A?

Sin embargo, el incluir un grupo piridin-3-ilo sustituido en posición 5 del anillo de oxazol para mejorar su afinidad y eficacia hacia α5 de receptor de GABA_A ya está divulgado en el documento D2 que se refiere a un hetereoarilo sustituido en dicha posición.

En consecuencia, la persona normalmente versada en la materia, estaría motivada a incluir un grupo heteroarilo sustituido del documento D2 en el compuesto de D1, para así llegar al objeto de la reivindicación 1. Por lo cual se considera obvia.

Adicionalmente, el documento D1 menciona una composición farmacéutica que comprende un compuesto derivado de isoxazol-piridazina y un vehículo.

Las reivindicaciones dependientes 2 a 9 así como la reivindicación 10 tampoco cumplen con el requisito de nivel inventivo.

6. Conclusión con respecto a novedad y/o nivel inventivo

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2009071477	1 a 10	Nivel inventivo
D2	WO2010112475	1 a 10	Nivel inventivo

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de 2000, 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

Oficio N° **8257** de **10 de julio de 2020**

Ref. Expediente N° NC2019/0002692

requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.

Si como respuesta a este requerimiento, el solicitante modifica: i) el capítulo reivindicatorio, ii) la descripción de la invención a proteger, iii) o presenta un nuevo capítulo reivindicatorio deberá observar las instrucciones contenidas en el numeral 1.2.2.1.1., del Capítulo Primero del Título X de la Circular Única y la Dirección de Nuevas Creaciones seguirá el procedimiento descrito en el numeral 1.2.2.5.1.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 6.2 del Capítulo Sexto del Título I de la Circular Única, informándoles que contra el mismo no procede recurso alguno en actuación administrativa.



Edna Marcela Ramirez Orozco
DIRECTORA DE NUEVAS CREACIONES



Oficio N° 8257 de 10 de julio de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0002692

INFORME DE BÚSQUEDA
EXAMEN DE PATENTABILIDAD

Solicitud No.		Examen de patentabilidad							
NC2019/0002692		1°	X	2°		3°		Revoca	
Solicitud Internacional No.		Fecha solicitud internacional: (DD/MM/AÑO)							
PCT/EP2017/081768		7 de diciembre de 2017							
Fecha de determinación estado de la técnica (DD/MM/AÑO)				Prioridad		Presentación			
8/12/2016				X					
Solicitante									
F. HOFFMANN-LA ROCHE AG									
Reivindicaciones que no son objeto de búsqueda por:									
Art. 14	-	Art. 15	-	Art. 20	-	Art. 25 (Falta de unidad de invención)		-	

CRITERIOS DE BÚSQUEDA	
Reivindicaciones objeto de búsqueda	1 - 10
Palabras clave utilizadas	PYRIDAZIN ISOXAZOLE PYRIDIN CABOXAMIDE GABA A ALFA5
Clasificaciones utilizadas para la búsqueda	CIP: C07D 413/14, A61K 31/4439, A61K 31/501, A61P 25/28
	CPC:

DOCUMENTOS CONSIDERADOS RELEVANTES (Documentos patente, Literatura no patente (LNP): Artículos, catálogos, etc.)					
Informes de búsqueda / Bases de datos consultadas	N° de solicitud de patente / N° de patente / Autor LNP ⁽¹⁾	Fecha de Publicación /Presentación (DD/MM/AAAA)	Reivindicaciones /Secuencias afectadas	Citas relevantes del estado de la técnica	Categoría del documento citado ⁽²⁾
SIPI			-	-	
ISA	WO2009071477	11/06/2009	1 - 10	Resumen, ejemplos, reivindicaciones	Y
	WO2009071476	11/06/2009	-	-	A
	WO2010112475	7/10/2010	1 - 10	Resumen, ejemplos, reivindicaciones	Y
Patbase	US2009143371	4/06/2009	-	-	A
	US20100286132	11/11/2010	-	-	A
	US2019300516	03/10/2019	-	-	P
STN NEXT	WO2018104419	14/06/2018	-	-	P
Googlepatent			-	-	-
Invenes			-	-	-
⁽¹⁾ Cita completa literatura no patente (LNP)					
Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. Nombre de la revista. Volumen(Número), pp-pp.					
O					
Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. Nombre de la revista. Recuperado de http://xxxxxxx.					
⁽²⁾ Categorías de documentos citados					
“A” Documento que define el estado general de la técnica no considerado como particularmente relevante.					
“T” Documento publicado en fecha posterior a la de presentación o la de prioridad de la solicitud internacional y no entra en conflicto con dicha					

Oficio N° 8257 de 10 de julio de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0002692

“E” Solicitud de patente o patente anterior pero publicada en la fecha de presentación internacional o en fecha posterior. “L” Documento citado para llamar la atención sobre por ejemplo, dudas acerca de una reivindicación de prioridad o para determinar la fecha de publicación de otra cita, siempre van acompañados de una explicación, por la cual se citan. “O” Documento del tipo actas de conferencia, este tipo de documentos siempre estará acompañado por otra letra que indique la pertinencia del documento, por ejemplo, O,X, O,Y o bien O,A. “P” Documento publicado antes de la fecha de presentación internacional pero con posterioridad a la fecha de prioridad reivindicada.	solicitud, pero puede ser útil para la mejor comprensión del principio o teoría en que se basa la invención, o para demostrar que el razonamiento o los hechos en los que se basa dicha invención son incorrectos. “X” Documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse nueva o que implique una actividad inventiva por referencia al documento aisladamente considerado. “Y” Documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse que implique una actividad inventiva cuando el documento se asocia a otro u otros documentos de la misma naturaleza, cuya combinación resulta evidente para un experto en la materia.
Fecha del reporte de búsqueda: (28/06/2020)	
Examinador: LINA PATRICIA FORERO TOBARIA	