

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES
2000-10

①

SOLICITUD DE:



Corrección de Error Material.



Modificación a una Solicitud.

②

SOLICITANTE

Nombre: **WARNER LAMBERT COMPANY .**

Dirección: **201 Tabor Road, Morris Plains**

Teléfono: **3419841** Fax:

E-mail:

Domicilio: **New Jersey, EE.UU**

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Número _____

③

**REPRESENTANTE
O APODERADO**

Nombre: **CARLOS ORLANDO MAYA RODRIGUEZ**

Dirección: **Carrera 7 No. 17-51 Ofc. 710**

Teléfono: **4009180** Fax: **3419841**

E-mail: **trademarks1@tutopia.com**

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Número **17.117.818** TP **17.402**

④ Número de expediente:

00-43067

⑤ Descripción de la corrección o modificación solicitada _____

CORRECCION EN LAS REIVINDICACIONES PRESENTADAS EN LA MODIFICACION

DEL PLIEGO REIVINDICATORIO RADICADO EL DIA 14 DE OCTUBRE DE 2003

SE ADJUNTA NUEVO PLIEGO REIVINDICATORIO

⑥ Comprobante de pago No.

03 - 85108

Fecha

Nov. 21 de 2003

⑦ Anexos:



Comprobante de pago de la tasa.



Poderes, si fuere el caso.



Certificado de existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.

⑧

NOMBRE

CARLOS ORLANDO MAYA R.

FIRMA

C. I. W. C. R.
C.C. **17.117.818** T.P. **17.402** C.S.J.

Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página.

2
408
406

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacon : 0004306/ 00010001 Folios: 15
Fecha (RGD): 2003-11-24 11:33:45
Trmite : 002 PATENTES D 352 PRESENTAC 329 CANCELACION
Dependencia: 2620 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

NIT : 800174009-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 03 - 85,108
FECHA : NOVIEMBRE 21 DE 2003

***** CONSIGNACION *****

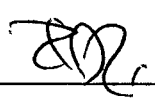
DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CARLOS TAMAYO	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	20040131	21/11/2003	1,799,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-03 CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	12 MARCAS Y LENAS COMERCIALES	82,000.00
	TOTAL :	\$ 82,000.00

SON: OCHENTA Y DOS MIL PESOS

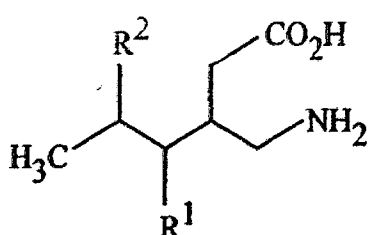
RESPONSABLE :



RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

488
487REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la Fórmula I



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, donde:

R¹ es hidrógeno, alquilo recto o ramificado de 1 a 6 átomos de carbono o fenilo,

R² es alquilo recto o ramificado de 4 a 8 átomos de carbono, alqueno recto o ramificado de 2 a 8 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono,

- alquilocicloalquilo,
- alquilalcoxi,
- alquil OH,
- alquilfenilo,
- alquilfenoxi, y
- fenilo sustituido.

ácido 3-aminometil-5-(4-metoxifenil)- hexanoico; o

ácido 3-aminometil-5-(fenilmetil)- hexanoico.

4. Un compuesto o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, que es:

ácido (3S, 5R)-3-aminometil-7-ciclobutil-5-metil-heptanoico;
ácido (3S, 5R)-3-aminometil-7-ciclopentil-5-metil-heptanoico;
ácido (3S, 5R)-3-aminometil-7-ciclohexil-5-metil-heptanoico;
ácido (3S, 5R)-3-aminometil-8-ciclopropil-5-metil-octanoico;
ácido (3S, 5R)-3-aminometil-8-ciclobutil-5-metil-octanoico;
ácido (3S, 5R)-3-aminometil-8-ciclopentil-5-metil-octanoico;
ácido (3S, 5R)-3-aminometil-8-ciclohexil-5-metil-octanoico;
ácido (3S, 5R)-3-aminometil-8-fluoro-5-metil-octanoico; y
ácido (3S, 5R)-3-aminometil-9-fluoro-5-metil-nonanoico.

8. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, y
seleccionado de:

ácido (3S, 5S)-3-aminometil-5-metoxi-hexanoico;
ácido (3S, 5S)-3-aminometil-5-etoxi-hexanoico;
ácido (3S, 5S)-3-aminometil-5-propoxi-hexanoico;
ácido (3S, 5S)-3-aminometil-5-isopropoxi-hexanoico;
ácido (3S, 5S)-3-aminometil-5-tert-butoxi-hexanoico;
ácido (3S, 5S)-3-aminometil-5-fluorometoxi-hexanoico;
ácido (3S, 5S)-3-aminometil-5-(2-fluoro-etoxi)-hexanoico;
ácido (3S, 5S)-3-aminometil-5-(3, 3, 3,-trifluoro-propoxi)-
hexanoico;
ácido (3S, 5S)-3-Aminometil-5-fenoxi-hexanoico;
ácido (3S, 5S)-3-Aminometil-5-(4-cloro-fenoxi)-hexanoico;

492 -8
494

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-6-(2-cloro-fenoxi)-5-metil-hexanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-6-(4-fluoro-fenoxi)-5-metil-hexanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-6-(3-fluoro-fenoxi)-5-metil-hexanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-6-(2-fluoro-fenoxi)-5-metil-hexanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-6-(4-metoxi-fenoxi)-5-metil-hexanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-6-(3-metoxi-fenoxi)-5-metil-hexanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-6-(2-metoxi-fenoxi)-5-metil-hexanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-5-metil 6-(4-trifluorometil-fenoxi)-hexanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-5-metil 6-(3-trifluorometil-fenoxi)-hexanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-5-metil 6-(2-trifluorometil-fenoxi)-hexanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-5-metil 6-(4-nitro-fenoxi)-hexanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-5-metil 6-(3-nitro-fenoxi)-hexanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-5-metil 6-(2-nitro-fenoxi)-
hexanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-6-benziloxi-5-metil-hexanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-7-hidroxí-5-metil-heptanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-7-metoxi-5-metil-heptanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-5-metil-7-propoxi-heptanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-7-isopropoxi-5-metil-heptanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-7-terc-butoxi-5-metil-heptanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-7-fluorometoxi-5-metil-heptanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-7-(2-fluoro-etoxi)-5-metil-
heptanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-5-metil-7-(3,3,3-trifluoro-
propoxi)-heptanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-7-benziloxi-5-metil- heptanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-5-metil-7-fenoxi-heptanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-7-(4-cloro-fenoxi)-5-metil-
heptanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-7-(3-cloro-fenoxi)-5-metil-
heptanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-7-(2-cloro-fenoxi)-5-metil-
heptanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-7-(4-fluoro-fenoxi)-5-metil-
heptanoico;

494
496

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-7-(3-fluoro-fenoxi)-5-metil-heptanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-7-(2-fluoro-fenoxi)-5-metil-heptanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-7-(4-metoxi-fenoxi)-5-metil-heptanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-7-(3-metoxi-fenoxi)-5-metil-heptanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-7-(2-metoxi-fenoxi)-5-metil-heptanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-5-metil-7-(4-trifluorometil-fenoxi)-heptanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-5-metil-7-(3-trifluorometil-fenoxi)-heptanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-5-metil-7-(2-trifluorometil-fenoxi)-heptanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-5-metil-7-(4-nitro-fenoxi)-heptanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-5-metil-7-(3-nitro-fenoxi)-heptanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-5-metil-7-(2-nitro-fenoxi)-heptanoico;

ácido (3S,5S)-3-Aminometil-5-metil-6-fenil-hexanoico;

496
498

heptanoico;

ácido (3S, 5R)-3-aminometil-7-(3-metoxi-fenil)-5-metil-

heptanoico;

ácido (3S, 5R)-3-aminometil-7-(2-metoxi-fenil)-5-metil-

heptanoico;

ácido (3S, 5R)-3-aminometil-7-(4-fluoro-fenil)-5-metil-

heptanoico;

ácido (3S, 5R)-3-aminometil-7-(3-fluoro-fenil)-5-metil-

heptanoico;

ácido (3S, 5R)-3-aminometil-7-(2-fluoro-fenil)-5-metil-

heptanoico;

ácido (3S, 5S)-3-aminometil-5-metil-hept-6-enoico;

ácido (3S, 5R)-3-aminometil-5-metil-oct-7-enoico;

ácido (3S, 5R)-3-aminometil-5-metil-non-8-enoico;

ácido (E)-(3S, 5S)-3-aminometil-5-metil-oct-6-enoico;

ácido (Z)-(3S, 5S)-3-aminometil-5-metil-oct-6-enoico;

ácido (Z)-(3S, 5S)-3-aminometil-5-metil-non-6-enoico;

ácido (E)-(3S, 5S)-3-aminometil-5-metil-non-6-enoico;

ácido (E)-(3S, 5R)-3-aminometil-5-metil-non-7-enoico;

ácido (Z)-(3S, 5R)-3-aminometil-5-metil-non-7-enoico;

ácido (Z)-(3S, 5R)-3-aminometil-5-metil-dec-7-enoico;

ácido (E)-(3S, 5R)-3-aminometil-5-metil-undec-7-enoico;

ácido (3S, 5S)-3-aminometil-5, 6, 6-trimetil-heptanoico;

ácido (3S, 5S)-3-aminometil-5-ciclopropil-hexanoico;

497 15
449

ácido (3S, 5S)-3-aminometil-5-ciclobutil-hexanoico;

ácido (3S, 5R)-3-aminometil-5-metil-8-fenil-octanoico;

ácido (3S, 5S)-3-aminometil-5-metil-6-fenil-hexanoico; y

ácido (3S, 5R)-3-aminometil-5-metil-7-fenil-heptanoico.

9. Un compuesto o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, de acuerdo con la reivindicación 1, donde R^2 es fenilo sustituido, o alquilfenilo, cicloalquilo o alquilocicloalquilo.

10. Un compuesto o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, de acuerdo con la reivindicación 1, donde R^2 es alquilfenoxi o alquilhidroxi.

11. Un compuesto o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, que se selecciona de:

ácido 3-aminometil-5-metilheptanoico;

ácido 3-aminometil-5-metil-octanoico;

ácido 3-aminometil-4,5-dimetil-hexanoico;

ácido (3S,4S)-3-aminometil-4,5-dimetil-hexanoico;

ácido (3R,4R)-3-aminometil-4,5-dimetil-hexanoico MP;

ácido 3-aminometil-4-isopropil-hexanoico;

ácido 3-aminometil-4-isopropil-heptanoico;

ácido (3S,5S)-3-aminometil-6-fluoro-5-metil-hexanoico;

498
500

ácido (3S,5S)-3-aminometil-7-fluoro-5-metil-heptanoico;

ácido (3S,5S)-3-aminometil-7,7,7-trifluoro-5-metil-heptanoico;

ácido (3S,5S)-3-aminometil-8,8,8-trifluoro-5-metil-octanoico;

ácido (3S,5S)-3-aminometil-5,6-dimetil-heptanoico;

ácido (3R,4R,5R)-3-aminometil-4,5-dimetil-heptanoico y

ácido (3R,4R,5R)-3-aminometil-4,5-dimetil-octanoico;

12. Una composición farmacéutica que comprende una cantidad efectiva de un compuesto de acuerdo con las reivindicaciones 1, 4, 5 ó 11 y un vehículo farmacéuticamente aceptable.

13. Un método para el tratamiento de la epilepsia, ataques de desmayo, hipoquinesia, trastornos craneanos, trastornos neurovegetativos, depresión, ansiedad, pánico, dolor, trastornos neuropatológicos, trastornos del sueño, daño gástrico o IBS, que comprende la administración de una cantidad terapéuticamente efectiva de un compuesto de las reivindicaciones 1, 4, 5 ó 11 a un mamífero que necesita dicho tratamiento.

14. Un método para el tratamiento de la epilepsia, ansiedad, pánico, dolor, trastornos del sueño, daño gástrico o IBS, que comprende la administración de una cantidad terapéuticamente

efectiva de un compuesto de las reivindicaciones 1, 4, 5 ó 11
a un mamífero que necesita dicho tratamiento.

502 500
2005-07-21
375

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

2020
Bogotá, D.C.,

Doctor
CARLOS ORLANDO MAYA
(Apoderado)

ASUNTO	Radicación	00043067
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio	
	Folios	007

05945

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 le comunica:

Documentos estudiados:

Los textos estudiados fueron la descripción (Folios: 2 a 183) y las reivindicaciones 1 a 14 (Folios: 489 a 501).

La presente solicitud reivindica prioridad americana N° US60.138485 de 10 de junio de 1999 y cumple con lo establecido en los artículos 9, 10 y 11 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina.

Objeto de invención:

La presente solicitud se titula: "Ácidos 3-propilgamma-aminobutíricos mono y disustituidos".

El objeto de la presente solicitud se refiere a ácidos 3-propilgamma-aminobutíricos mono y disustituidos de fórmula I (ver folio: 3) o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma. Algunos de los compuestos de la presente solicitud pueden existir en formas no solvatadas así como también formas solvatadas, incluyendo formas hidratadas. En general, las formas solvatadas, que incluyen formas hidratadas, son equivalentes a formas no solvatadas e intentan incluirse dentro del alcance de la presente solicitud.

Según la descripción, los compuestos de la presente solicitud se comparan con Neurintin, un fármaco comercializado efectivo en el tratamiento de trastornos tales como la epilepsia, Neurontin es ácido 1-(aminometil)-ciclohexanaacético. La gabapentina (Neurontin) tiene 0.10 a 0.12 mM de afinidad a la subunidad alfa2-delta. Por esta razón, se espera que los compuestos de la presente solicitud exhiban propiedades farmacológicas comparables con o mejores que la gabapentina. Por ejemplo, como agentes para convulsiones, ansiedad y dolor.

La presente solicitud también se relaciona con el uso terapéutico como agentes para los trastornos neurodegenerativos, como por ejemplo: enfermedad de Alzheimer,

Huntington o la enfermedad de Parkinson y esclerosis lateral amiotrófica. También para el tratamiento de trastornos neurodegenerativos denominado lesión cerebral aguda. Estos incluyen pero no se limitan a: apoplejía, trauma cerebral y asfixia.

Lo que se reivindica como novedoso es lo siguiente:

Ácidos 3-propilgamma-aminobutíricos mono- y disustituídos de fórmula I (ver folio: 489) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

El objeto de la solicitud definido anteriormente se clasificó en la IPC A61K 31/19, 31/13.

Excepciones de Patentabilidad:

El artículo 20 de la Decisión 486 se establece: "No serán patentables: a) las invenciones cuya explotación comercial en el territorio del País Miembro respectivo deba impedirse necesariamente para proteger el orden público o la moral. A estos efectos la explotación comercial de una invención no se considerará contraria al orden público o a la moral solo debido a la existencia de una disposición legal o administrativa que prohíba o que regule dicha explotación; b) las invenciones cuya explotación comercial en el País Miembro respectivo deba impedirse necesariamente para proteger la salud o la vida de las personas o de los animales, o para preservar los vegetales o el medio ambiente. A estos efectos la explotación comercial de una invención no se considerará contraria a la salud o la vida de las personas, de los animales, o para la preservación de los vegetales o del medio ambiente sólo por razón de existir una disposición legal o administrativa que prohíba o que regule dicha explotación; c) las plantas, los animales y los procedimientos esencialmente biológicos para la producción de plantas o animales que no sean procedimientos no biológicos o microbiológicos; d) los métodos terapéuticos o quirúrgicos para el tratamiento humano o animal, así como los métodos de diagnóstico aplicados a los seres humanos o a animales."

De acuerdo con lo anterior, la(s) reivindicación(es): 13 y 14 (Folios: 500 y 501), que se refieren a un método para el tratamiento de la epilepsia, no es (son) patentable(s).

Determinación del estado de la técnica:

El artículo 16 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece que "El estado de la técnica comprenderá todo lo que haya sido accesible al público por una descripción escrita u oral, utilización, comercialización o cualquier otro medio antes de la fecha de presentación de la solicitud de Patente o, en su caso, de la prioridad reconocida."

Sólo para el efecto de la determinación de la novedad, también se considerará dentro del estado de la técnica, el contenido de una solicitud de patente en trámite ante la oficina nacional competente, cuya fecha de presentación o de prioridad fuese anterior a la fecha de presentación o de prioridad de la solicitud de patente que se estuviese examinando, siempre que dicho contenido esté incluido en la solicitud de fecha anterior cuando ella se publique o hubiese transcurrido el plazo previsto en el artículo 40".

Considerando que la fecha de presentación de la primera solicitud de patente de la cual se reivindica prioridad es: 10/06/1999, se buscaron documentos del estado de la técnica relacionados, con fecha de publicación anterior a esta.

Se hizo la búsqueda de documentos relevantes en el estado de la técnica, entendiendo como estado de la técnica la definición provista en el artículo 16 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina y las excepciones fijadas en el artículo 17 de la misma.

Se encontró como anterioridades (documentos cuya fecha de publicación es anterior a la fecha de presentación de la primera solicitud de patente sobre la cual se reivindica prioridad o de la fecha de presentación de esta solicitud) que pueden afectar la patentabilidad del objeto de la presente solicitud:

Nº	Documento	Título	Fecha de Publicación
1	WO 92/09560	GABA and L-glutamic acid analogs for antiseizure treatment	11 de junio de 1992

Evaluación de los requisitos de Patentabilidad:

El Artículo 14 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina el cual establece: "Los Países Miembros otorgarán Patentes para las invenciones, sean de producto o de procedimiento en todos los campos de la tecnología siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial".

Se procedió a evaluar los requisitos de novedad, nivel inventivo y aplicación industrial con el fin de establecer la patentabilidad de la invención reivindicada en la solicitud en estudio.

Evaluación de Nivel Inventivo:

El artículo 18 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece que "Se considerará que una invención tiene nivel inventivo, si para una persona del oficio normalmente versada en la materia técnica correspondiente, esa invención no hubiese resultado obvia ni se hubiese derivado de manera evidente del estado de la técnica".

El Nivel Inventivo se evaluó por comparación entre lo solicitado y encontrado en el estado de la técnica y que se relaciona con el objeto reivindicado y de acuerdo con la definición de nivel inventivo del Artículo 18 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina.

La Solicitud de Patente Colombiana No. 00043067 menciona compuestos ácidos 3-propilgamma-aminobutíricos mono- y disustituidos de fórmula I (ver folio: 489).

El documento **WO 92/09560** (folios:) menciona compuestos análogos de GABA y ácido glutámico para el tratamiento de la epilepsia y enfermedades relacionadas, donde la diferencia estructural con respecto a los compuestos de la presente solicitud se encuentra en R2 de la presente solicitud, cuando es un alquilo de 4 a 8 carbonos que junto con la cadena al que está unido forma una cadena ramificada de mínimo 7 carbonos mientras que en la anterioridad el grupo equivalente a R2 y la cadena al que va unido formaría una cadena ramificada de hasta 6 carbonos. No obstante esta diferencia estructural, no cambia la actividad farmacológica, es decir, los compuestos de tanto la presente solicitud como de la anterioridad se emplean para tratar las mismas enfermedades relacionadas con el GABA, lo cual le muestra a una persona medianamente versada en la materia que los compuestos de la presente solicitud son derivados del estado de la técnica.

La respuesta al problema técnico que se pretendía resolver, resulta obvia partiendo de la anterioridad WO 92/09560.

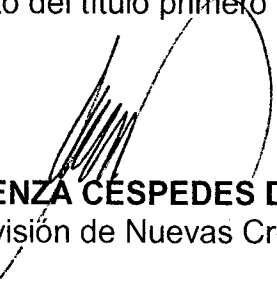
Como se observa, el objeto de esta solicitud podría resultar obvio para una persona del oficio normalmente versada en la materia y derivarse de manera evidente del estado de la técnica.

En conclusión los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

Nº	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
1	WO 92/09560	1 a 12	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 días contados a partir de la fecha de la 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.

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 N° 10 de 2001.


ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL

Jefe de la División de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 21 JUL. 2005

CONCEPTO TÉCNICO Nº: 1040	EXAMINADOR TÉCNICO Código N°: 202005	EXAMINADOR JURÍDICO Código N°:
------------------------------	---	-----------------------------------

INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

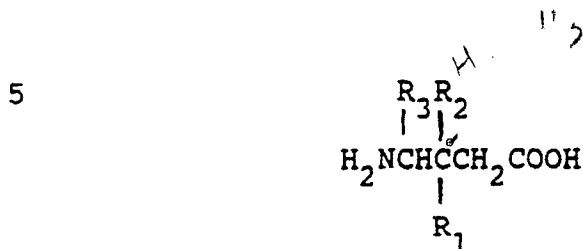
506
504

(51) International Patent Classification ⁵ : C07C 229/08, 229/24, 229/28 C07C 229/34, 229/36 A61K 31/195	A1	(11) International Publication Number: WO 92/09560 (43) International Publication Date: 11 June 1992 (11.06.92)
(21) International Application Number: PCT/US91/08701 (22) International Filing Date: 20 November 1991 (20.11.91) (30) Priority data: 618,692 27 November 1990 (27.11.90) US (71) Applicant: NORTHWESTERN UNIVERSITY [US/US]; 633 Clarck Street, Evanston, IL 60208 (US). (72) Inventor: SILVERMAN, Richard, B. ; 7817 Beckwith Road, Morton Grove, IL 60053 (US). (74) Agent: TILTON, Timothy, L.; Tilton, Fallon, Lungmus & Chestnut, 100 So. Wacker Dr., Suite 960, Chicago, IL 60606 (US).		(81) Designated States: AT (European patent), AU, BE (European patent), CA, CH (European patent), DE (European patent), DK (European patent), ES (European patent), FI, FR (European patent), GB (European patent), GR (European patent), IT (European patent), JP, KR, LU (European patent), NL (European patent), NO, SE (European patent). Published <i>With international search report.</i>
(54) Title: GABA AND L-GLUTAMIC ACID ANALOGS FOR ANTISEIZURE TREATMENT (57) Abstract Novel analogs of GABA and L-glutamic acid are used for treating seizure disorders. One analog, 4-amino-3-(2-methylpropyl) butanoic acid is found to have unexpectedly potent antiseizure activity <i>in vivo</i>.		

507
505

What is claimed is:

1. A compound of the formula



wherein R_1 is a straight or branched alkyl of from
 10 one to six carbons, a phenyl, or a cycloalkyl having
 from 3 to 6 carbon atoms, R_2 is hydrogen or methyl,
 and R_3 is hydrogen; methyl or carboxyl; or its
 diastereomers; or enantiomers; and both
 pharmaceutically acceptable salts thereof.

15

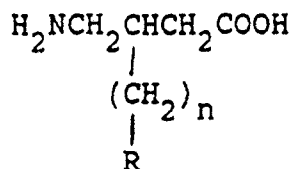
2. A compound as set forth in claim 1
 wherein R_3 is hydrogen, R_2 is hydrogen, and R_1 is
 $-(\text{CH}_2)_n-\text{i C}_4\text{H}_9$ as an (R), (S) or (R,S) isomer, n
 being 0-2.

20

3. A compound as set forth in claim 2 and
 being 4-amino-3-(2-methylpropyl)butanoic acid.

4. The use of a compound for treating
 25 seizure disorders in a patient which comprises
 administering to the patient an effective amount of
 the compound of the formula

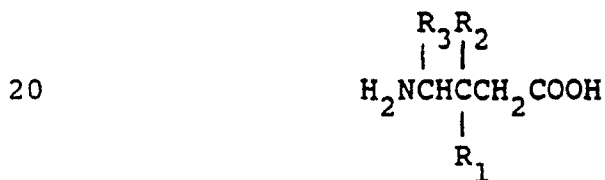
500
506



5 wherein R is an isobutyl; n is zero, one, or two and its enantiomers or a pharmaceutically acceptable salt thereof.

5. The use of a compound as set forth in
10 claim 4 wherein the compound is 4-amino-3-(2-methylpropyl)butanoic acid or a pharmaceutically acceptable salt thereof.

6. A method of treating seizure disorders
15 in a patient, said method including the steps of administering an anticonvulsant effective amount of a composition having the formula



wherein R_1 is a straight or branched alkyl of from one to six carbons, a phenyl or a cycloalkyl of 3 to
25 6 carbons, R_2 is hydrogen or methyl, and R_3 is hydrogen, methyl or carboxyl; or its diastereomers; or enantiomers; and pharmaceutically acceptable salts thereof.