

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

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
CARLOS OLARTE
office@olartemoure.com

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-126001- -00008-0000

Fecha: 2012-09-26 10:38:39 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 519 TRASLADOINFORME Folios: 7

ASUNTO	Radicación	09 - 126001
	Trámite	011
	Evento	378
	Actuación	519
	Oficio	
	Folios	7

EE- 17 3 2 3

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad
Vía Nacional		
Vía PCT (Fase Nacional)	☒	Capítulo I ☒ Capítulo II

No. Solicitud Internacional: PCT/US2008005777
Fecha de Presentación Internacional: Mayo 5 de 2008

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 295 a 586	Noviembre 6 de 2009
Reivindicaciones	Folios 587 a 631	Noviembre 6 de 2009
Oposiciones	Folios 688 a 698	Lafrancoi Abril 14 de 2011
Prioridad:	US 60916.458	Mayo 7 de 2007

2. Análisis de la Prioridad

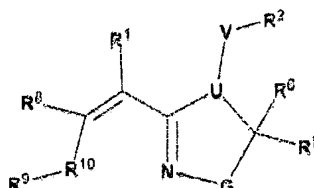
Se acepta la reivindicación de Prioridad porque esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "Moduladores de gamma secretasa"

El problema planteado en esta solicitud consiste en obtención de compuestos con actividad moduladora de gamma secretasa y de esta manera obtener preparaciones farmacéuticas para el tratamiento del Alzheimer y otras enfermedades neurodegenerativas.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio plantea la obtención de compuestos heterocíclicos o sus sales farmacéuticamente aceptables con actividad moduladora de gamma secretasa, para el tratamiento de enfermedades neurodegenerativas.



El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K31/4245; A61P25/00; A61P25/28; C07D413/10; C07D413/14; C07D498/04; C07D498/10; C07D498/20

4. Excepción a la Patentabilidad (Art 20 D 486 literal d)

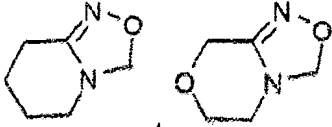
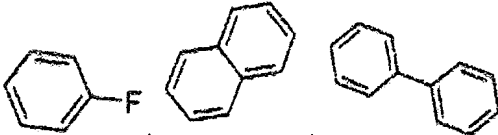
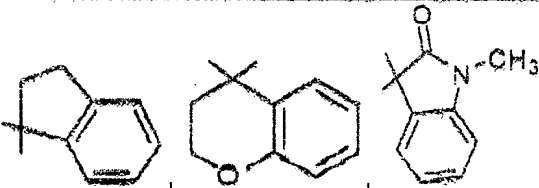
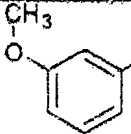
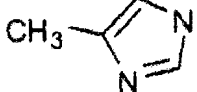
El objeto de las reivindicaciones 73 a 84 no es patentable de acuerdo con el artículo citado

5. De la solicitud de la Patente

Reivindicaciones (Art 30 D486 Art 22 PCT)

El capítulo reivindicatorio no es conciso porque contiene muchas reivindicaciones dependientes. Se solicita restringir la cantidad de estas reivindicaciones, de manera más específica, las reivindicaciones 30 a 65 reivindican cada una, un compuesto diferente. Se solicita omitir varias de estas reivindicaciones, de tal manera que se protejan los compuestos de real interés para el inventor.

Las reivindicaciones 1 y 2 como reivindicaciones independientes no son concisas porque se emplean expresiones muy generales tales como "alquilo", "alquenilo", "alquinilo", "arilo", "arilalquilo", "alquilarilo", "cicloalquilo", "cicloalquilarilo", "heteroarilo", "heteroarilalquilo", "heterociclilo", entre otras. Además, para todos los sustituyentes se plantean muchísimas posibilidades de sustitución, lo cual genera una alta complejidad para los compuestos a obtener y por lo tanto, no se puede obtener un alcance certero de lo que se reclama dentro de esta invención. Se sugiere hacer limitar la solicitud a una generalización razonable, de tal manera que en esta solicitud de invención se protejan los compuestos de real interés para el inventor. Se sugiere realizar dichas limitaciones para todos los sustituyentes de acuerdo a los compuestos soportados dentro del capítulo descriptivo, como se muestra en la siguiente tabla:

Sustituyente	Soportado en la descripción
U	N
G	O
V	Es un enlace
R ²	Metoxipropil, bencil, t-butoxi
R ¹ , R ² y V forman conjuntamente	
R ⁵	Meil, etoxi, t-butoxi, metoximetil, isopropoxi,
R ⁷	 opcionalmente sustituidos por F o OCF ₃
R ⁶ y R ⁷ forman conjuntamente	 opcionalmente sustituidos por F o OCF ₃
R ¹⁰	
R ⁹	

La reivindicación 72 no es concisa porque posee demasiados numerales donde se incluyen muchas combinaciones farmacéuticas con otros agentes terapéuticos. Se solicita restringir las posibilidades de combinación a una cantidad mas razonable y que se consideren de real interés para el inventor.

6. Análisis de la Oposición

Argumento de Lafrancel

Afirma el oponente que esta solicitud pretende obtener patente para composiciones farmacéuticas donde se combinan los compuestos de la invención con compuestos conocidos ampliamente en el Estado de la Técnica e indicados para el tratamiento del Alzheimer y otras enfermedades neurodegenerativas, particularmente con Donepezilo, Atorvastatina, Pitavastatina, Rosuvastatina y Ezetimiba, tal como lo enuncia la reivindicaciones 68 a 72 de esta solicitud.

El argumento del opositor es que las composiciones y combinaciones farmacéuticas referidas a compuestos heterociclos inhibidores de la gamma secretasa para tratamiento del Alzheimer y de las enfermedades neurodegenerativas, son prácticas y eventos ampliamente conocidos en la industria farmacéutica y que por lo tanto no presentan novedad ni nivel inventivo.

Además, el opositor afirma que no pueden gozar de beneficio patentario las composiciones y combinaciones farmacéuticas con las moléculas mencionadas, dado que estas se encuentran descubiertas y plenamente identificadas en el sector químico farmacéutico, que cuentan con beneficios patentarios otorgados por las oficinas europea y norteamericana.

También, esta solicitud busca obtener beneficios patentarios métodos de tratamiento en sus puntos 10 a 13, los cuales no se pueden considerar como invenciones.

Como documento soporte, el opositor adjunta las monografías del Donepezilo (The Merck Index, pagina 578), Atorvastatina (The Merck Index, páginas 143 - 144), Pitavastatina (The Merck Index, páginas 1294 - 1295), Rosuvastatina (The Merck Index, pagina 1428) y Ezetimiba (The Merck Index, pagina 668).

Respuesta del examinador Técnico

Se revisa el artículo 15 de la Decisión 486 y este no considera que las combinaciones farmacéuticas entre moléculas conocidas en el estado de la Técnica y nuevas moléculas no sean patentables, como lo afirma el opositor. La composición farmacéutica donde se combinan los compuestos de esta invención con otros principios activos ya conocidos de acuerdo a lo propuesto en la reivindicaciones 68 a 72 de esta solicitud, no se encuentran divulgados dentro del Estado de la Técnica ni se establece si estas composiciones tengan un efecto técnico inferior, similar o ventajoso con respecto a lo conocido en el Estado de la Técnica.

En cuanto a los métodos de tratamiento, cabe aclarar que el opositor se equivoca en afirmar que estos están en los puntos 10 a 13 de la solicitud. Aunque su apreciación es correcta al oponerse a la patentabilidad de los métodos de tratamiento y en efecto, la patentabilidad de estos se objeta en este examen, realmente la mención de los métodos de tratamiento se realiza en las reivindicaciones 73 a 84.

Los documentos presentados en esta Oposición no generan un soporte lógico ni suficiente para desvirtuar la Novedad o el Nivel Inventivo de esta composición de las reivindicaciones 68 a 72 de esta solicitud, por lo cual no se considerará dentro del Examen de Patentabilidad

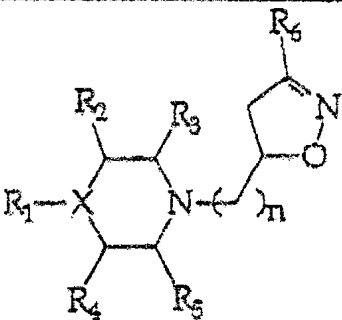
7. Determinación del Estado de la Técnica

El Estado de la Técnica se determinó con base en la fecha de solicitud de prioridad: Mayo 7 de 2007 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	GB2369617	Isoxazolylalkyl-piperazine and -piperidine derivatives having selective biological activity at dopamine D3 or D4 receptor	Junio 5 de 2002
D2	US4012377	Oxadiazole and oxadiazoline derivatives	Marzo 15 de 1977

D1: Divulga compuestos derivados de dihidroisoxazol alquilpiperazina como agentes dopaminérgicos D3 y D4

http://worldwide.espacenet.com/maximizedOriginalDocument?flavour=maximizedPlainPage&locale=es_LP&FT=D&date=20020605&CC=GB&NR=2369617A&KC=A



D2: Divulga compuestos derivados de oxadiazol como agentes antiparasitarios

http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=4012377A&KC=A&FT=D&ND=3&date=19770315&DB=EPODOC&locale=es_LP



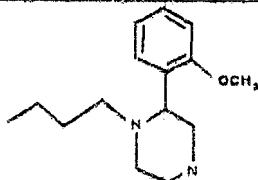
8. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

La reivindicación 1 divulga un compuesto o sales, solvatos, esteres, o profármacos farmacéuticamente aceptables del compuesto de la Fórmula I donde... (Folios 587 a 593)

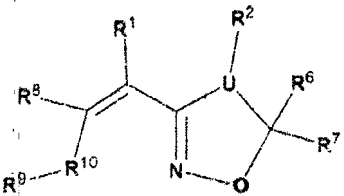
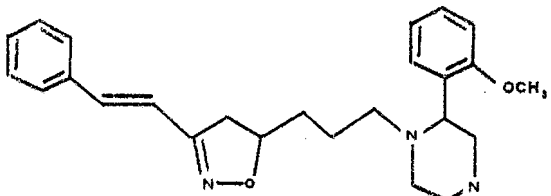
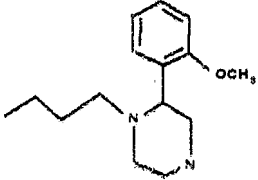
Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Solicitud	D1
Compuesto de la Formula I G es O	1(2-metoxifenil)-[4-3-estiril-4,5-dihidroisoxazol-5-il]butil]piperazina
Posición 4 anillo de isooxazol: U es CR ⁵ , (donde R ⁵ es H) V es un enlace y R ² es H para formar CH ₂	CH ₂ en posición 4 del anillo de isooxazol
R ¹ y R ³ son H	H en los carbonos que conforman el doble enlace

R ¹⁰ es un enlace y R ⁹ es un arilo o un heterociclo	Fenil
R ⁶ es H y R ⁷ entre muchas opciones, es un heterociclilalquilo sustituido por un arilo	

La reivindicación 2 divulga un compuesto o sales, solvatos, esteres, o profármacos farmacéuticamente aceptables del compuesto de la Fórmula II donde... (Folios 594 a 596)

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

Solicitud	D1
Compuesto de la Formula II 	 1(2-metoxifenil)-[4-3-estiril-4,5-dihidrosioxazol-5-il]butil]piperazina
Posición 4 anillo de isooxazol: U es CR ⁵ , (donde R ⁵ es H) y R ² es H para formar CH ₂	CH ₂ en posición 4 del anillo de isooxazol
R ¹ y R ⁹ son H	H en los carbonos que conforman el doble enlace
R ¹⁰ es un enlace y R ⁹ es un arilo o un heterociclo	Fenil
R ⁶ es H y R ⁷ entre muchas opciones, es un heterociclilalquilo sustituido por un arilo	

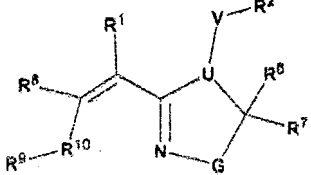
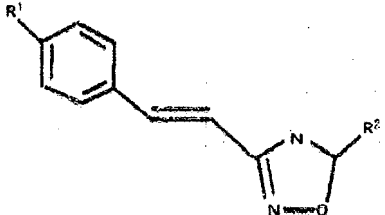
Las características esenciales de los compuestos de la reivindicaciones 1 y 2 habían sido divulgados previamente en el Estado de la Técnica D1 (D1: Folio 8, líneas 9 y 10, compuesto 5) quien enseña un compuesto derivado de isoxazol sustituido por un grupo estiril en posición 3 y sustituido en posición 5 por (2-metoxifenilpiperazin – 1il)butil, como un compuesto con actividad dopaminérgica en receptores D3 y D4

En consecuencia, la reivindicaciones 1 y 2 según lo divulgado por D1 carecen de Novedad.

Las reivindicaciones 3, 5, 7, 9, 14, 15, 16 y 19 dependientes de la reivindicación 1 no aportan conceptos que otorguen características nuevas, por lo tanto, estas reivindicaciones también carecen de Novedad.

La reivindicación 1 divulga un compuesto o sales, solvatos, esteres, o profármacos farmacéuticamente aceptables del compuesto de la Fórmula I donde... (Folios 587 a 593)

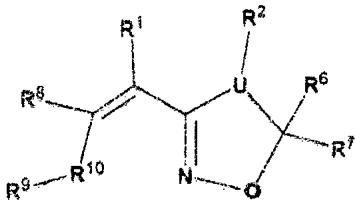
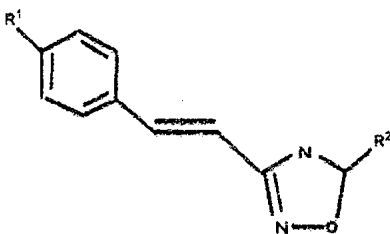
Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Solicitud	D2
Compuesto de la Formula I  G es O	Se identifican derivados del 3-estiril-1,2,4-oxadiazol 

Posición 4 anillo de isooxazol: U es N, V es un enlace y R ² es H para formar NH	NH en posición 4 del anillo de isooxazol
R ¹ y R ⁶ son H	H en los carbonos que conforman el doble enlace
R ¹⁰ es un enlace y R ⁹ es un arilo o un heterociclo sustituido por alquilo, halógeno, ciano, arilo	Fenil sustituido por Cl, Br, F, ciano
R ⁶ y R ⁷ entre muchas opciones, pueden ser H o alquilo en posición 5 del anillo de oxadiazol	La posición 5 del anillo de oxadiazol se sustituye por H, metil o etil

La reivindicación 2 divulga un compuesto o sales, solvatos, ésteres, o profármacos farmacéuticamente aceptables del compuesto de la Fórmula II donde... (Folios 594 a 596)

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

Solicitud	D2
Compuesto de la Formula II 	Se identifican derivados del 3-estiril-1,2,4-oxadiazol 
Posición 4 anillo de isooxazol: U es N, R ² es H para formar NH	NH en posición 4 del anillo de isooxazol
R ¹ y R ⁶ son H	H en los carbonos que conforman el doble enlace
R ¹⁰ es un enlace y R ⁹ es un arilo o un heterociclo	Fenil sustituido por Cl, Br, F, ciano
R ⁶ es H y R ⁷ entre muchas opciones, es un heterociclilalquilo sustituido por un arilo	La posición 5 del anillo de oxadiazol se sustituye por H, metil o etil

Las características esenciales de los compuestos de la reivindicaciones 1 y 2 habían sido divulgados previamente en el Estado de la Técnica D2 (D2: Folio 3, párrafo 3, líneas 3 a 8) quien enseña compuestos derivados de oxadiazol sustituido por un grupo estiril en posición 3 y sustituido en posición 5 por H, metil o etil, con actividad antiparasitaria.

Los compuestos ya divulgados en D2 como tales como: 3-estiril-1,2,4-oxadiazol; 3-(p-cloro)estiril-1,2,4-oxadiazol; 3-(p-bromo)estiril-1,2,4-oxadiazol; 3-(p-fuoro)estiril-1,2,4-oxadiazol; 3-(p-ciano)estiril-1,2,4-oxadiazol, se incluyen dentro de lo que la solicitud desea reclamar.

En consecuencia, la reivindicaciones 1 y 2 según lo divulgado por D2 carecen de Novedad.

Las reivindicaciones 4, 5, 7, 9, 14, 15, 16 y 19 dependientes de la reivindicación 1 no aportan conceptos que otorguen características nuevas, por lo tanto, estas reivindicaciones también carecen de Novedad.

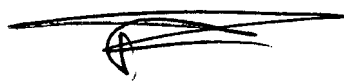
9. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	GB2369617	1, 2, 3, 5, 7, 9, 14, 15, 16 y 19	Novedad
D2	US4012377	1, 2, 4, 5, 7, 9, 14, 15, 16 y 19	Novedad

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.

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.



JOSE LUIS SALAZAR LOPEZ
Director de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha

02 OCT. 2012

Elaborado por: Alexander Ramírez Reyes
Revisado por: Gloria Jacqueline Alfonso

