

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
 Bogotá, D.C.,

Abogado
 CARLOS OLARTE
office@olartemoure.com

ASUNTO	Radicación	09 – 137086
	Trámite	011
	Evento	378
	Actuación	519
	Oficio	
	Folios	7

UFE 17017

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

No. Solicitud Internacional:	PCT/US2008006734
Fecha de Presentación Internacional:	Mayo 28 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 323 a 592	Diciembre 1 de 2009
Reivindicaciones	Folios 593 a 670	Diciembre 1 de 2009
Oposiciones	Folios 705 a 716	Lafrancol Abril 14 de 2011
Prioridad:	US 60941.405	Junio 1 de 2007
	US 60984.484	Noviembre 1 de 2007

2. Análisis de la Prioridad

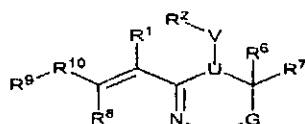
Se acepta la reivindicación de Prioridad porque esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

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): A61K31/4166; A61K31/517; A61K31/519; A61P25/28; C07D403/10;

C07D471/04; C07D487/04; C07D498/04

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

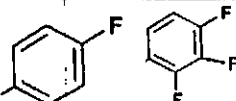
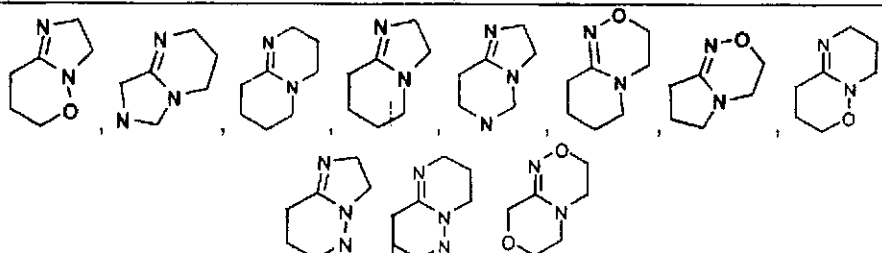
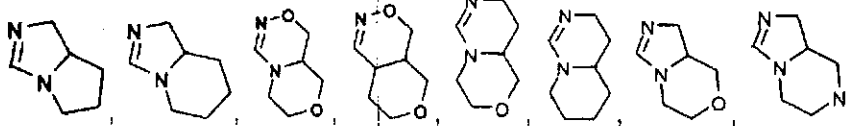
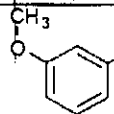
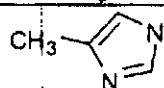
El objeto de las reivindicaciones 65 a 76 no es patentable de acuerdo con el artículo citado

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 1 a 4 como reivindicaciones independientes no son concisas porque se emplean expresiones muy generales tales como "alquilo", "alquenilo", "alquinilo", "arilo", "arilalquilo", "alquilarilo", "cicloalquilo", "cicloalquilarilo", "heteroarilo", "heteroarilalquilo", "heterocicilo", entre otras. Además, para todos los sustituyentes se plantean muchísimas posibilidades de sustitución, obteniendo una cantidad innumerable y desproporcionada de compuestos 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	C
W	Enlace, C, O
V	Enlace, O, C=O
R ¹ y R ⁸	H
R ²	Metil, metoxipropil
R ⁶	Metil, hidroxil, hidroximetil
R ⁷	
R ¹ , R ² y V forman con el anillo central	
R ² , R ⁶ y V forman con el anillo central	
R ¹⁰	
R ⁹	

Las reivindicaciones 16, 32, 45, 46 y 50 a 53 no son concisas porque poseen muchos numerales. Se solicita reducir la cantidad de numerales y en lo posible consolidar las condiciones de estas reivindicaciones a pocos enunciados breves que sean claros y concisos.

La reivindicación 54 no es concisa porque presenta una cantidad excesiva de compuestos. Se solicita disminuir la cantidad de compuestos a una cifra mas razonable, los cuales representen real interés para el inventor.

Las reivindicaciones 60, 61 y 64 no son concisas porque posee demasiados numerales donde se incluyen muchas combinaciones farmacéuticas con otros agentes terapéuticos. Se solicita restringir las posibilidades de combinación a una cantidad más razonable y que se consideren de real interés para el inventor.

6. Análisis de la Oposición

Argumento de Lafranco

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, Pravastatina, Rivastigmina y Ezetimiba, tal como lo enuncia la reivindicaciones 60 a 65 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 2 a 5, 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), Pravastatina (The Merck Index, páginas 1325), Rivastigmina (The Merck Index, pagina 1422 – 1423) 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 60 a 65 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 2 a 5 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 65 a 76.

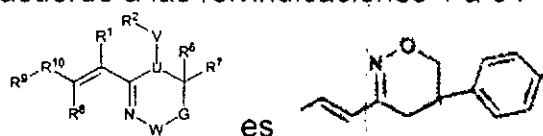
Los documentos presentados en esta Oposición no generan un soporte lógico ni suficiente para desvirtuar la Novedad o el Nivel Inventivo de esta composición de las reivindicaciones

68 a 72 de esta solicitud, por lo cual no se considerará dentro del Examen de Patentabilidad

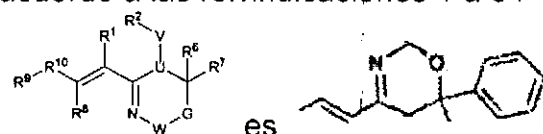
7. Unidad de Invención (Art 25 D 486)

La solicitud no cumple con el requisito de Unidad de Invención, porque esta se refiere a 13 Grupos Inventivos diferentes, los cuales no generan un concepto inventivo común. Los Grupos Inventivos identificados son los siguientes:

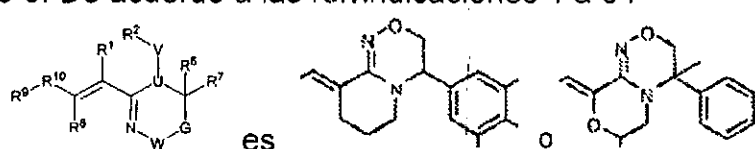
- Grupo Inventivo 1: De acuerdo a las reivindicaciones 1 a 64



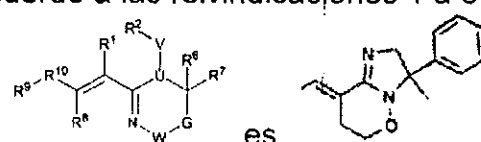
- Grupo Inventivo 2: De acuerdo a las reivindicaciones 1 a 64



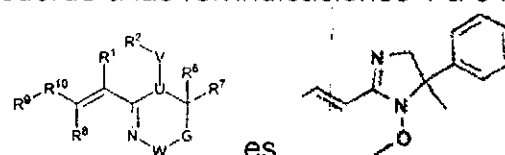
- Grupo Inventivo 3: De acuerdo a las reivindicaciones 1 a 64



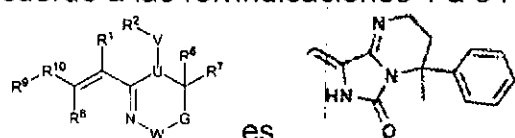
- Grupo Inventivo 4: De acuerdo a las reivindicaciones 1 a 64



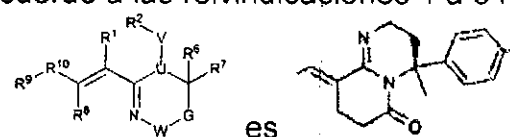
- Grupo Inventivo 5: De acuerdo a las reivindicaciones 1 a 64



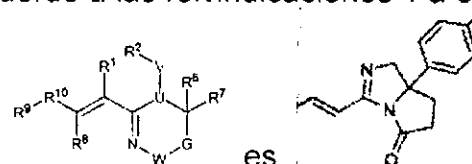
- Grupo Inventivo 6: De acuerdo a las reivindicaciones 1 a 64



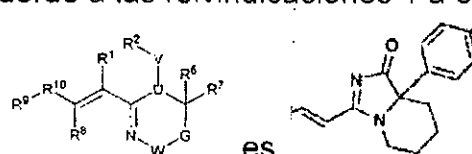
- Grupo Inventivo 7: De acuerdo a las reivindicaciones 1 a 64



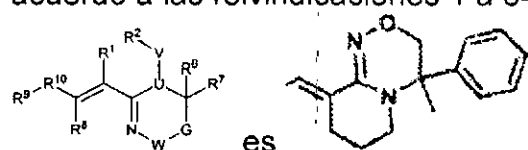
- Grupo Inventivo 8: De acuerdo a las reivindicaciones 1 a 64



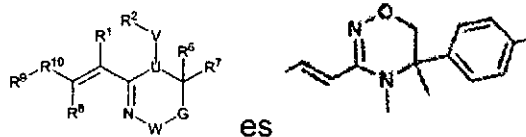
- Grupo Inventivo 9: De acuerdo a las reivindicaciones 1 a 64



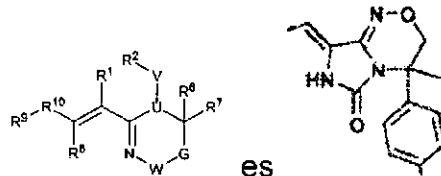
- Grupo Inventivo 10: De acuerdo a las reivindicaciones 1 a 64



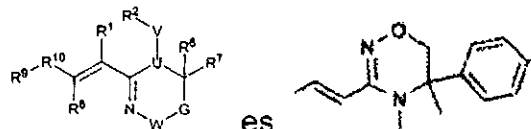
- Grupo Inventivo 11: De acuerdo a las reivindicaciones 1 a 64



- Grupo Inventivo 12: De acuerdo a las reivindicaciones 1 a 64



- Grupo Inventivo 13: De acuerdo a las reivindicaciones 1 a 64



Se sugiere presentar las Solicitudes Divisionales para los grupos Inventivos de interés o se sugiere limitar la solicitud a un solo Grupo Inventivo, eliminando de esta solicitud los demás Grupos Inventivos.

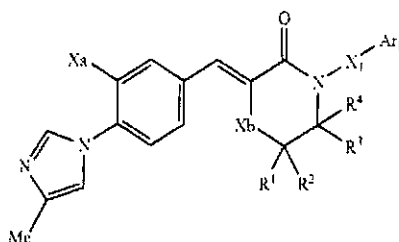
8. Determinación del Estado de la Técnica

El Estado de la Técnica se determinó con base en la fecha de solicitud de prioridad: Junio 1 de 2007 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	US2007117798	Morpholine type cinnamide compounds	Mayo 24 de 2007

D1: Divulga compuestos derivados de morfolina como inhibidores de gamma secretasa para el tratamiento de enfermedades neurodegenerativas

<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2007117798A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20070524&DB=EPODOC&locale=es> LP



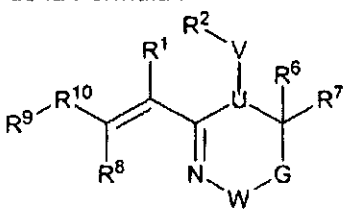
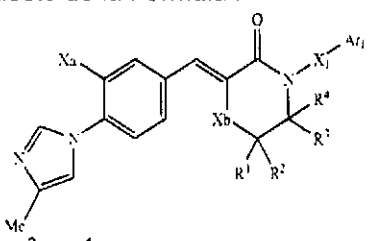
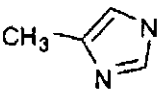
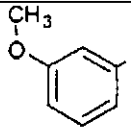
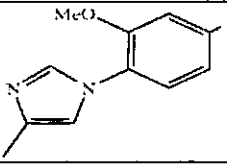
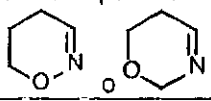
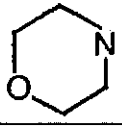
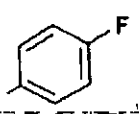
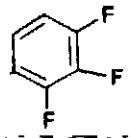
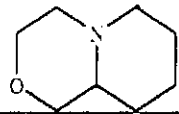
9. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel Inventivo (Art 18 D486)

Para los grupos inventivos 1 y 2

La reivindicación 1 divulga un compuesto o sales, solvatos, ésteres, o profármacos farmacéuticamente aceptables del compuesto de la Fórmula I en la cual... (Folios 593 a 602)

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

Solicitud	D1
Compuesto de la Formula I 	Compuesto de la Formula I 
R ¹ y R ⁸ son H V es O y R ² es H formando C-OH	R ¹ , R ² , R ³ y R ⁴ son H Grupo carbonilo C=O
R ⁹ es  y R ¹⁰ es 	
W es C ó O y G es C ó O para formar 	
R ⁷ es   o arilalquilo R ² y R ⁶ forman en conjunto con el anillo central un cicloalquilo o heterociclo de 5 a 8 miembros	X ₁ es metilo y Ar es Fenil o Piridina sustituidos por halógeno Se puede formar un anillo heterociclo bifusionado 

D1 se considera el Estado de la Técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1, porque divulga compuestos derivados de morfolina tipo cinamil con actividad en receptores beta y gama secretasa para disminuir la acción de proteína β – amiloide para el tratamiento del Alzheimer y otras enfermedades neurodegenerativas (D1: Folios 2 a 6 y 41 a 42).

La diferenciá entre la invención y D1 consiste en que en la posición 4 del anillo principal el sustituyente en D1 es un oxo mientras que para la invención es hidroxilo y que en D1 en la posición 3 se sustituye por un bencil vinilén donde el imidazol es sustituyente del anillo de benceno, mientras que en la invención solicitada en la posición 3 se sustituye por un estiril, donde el imidazol también sustituye al benceno. Además en D1 el anillo central es una 1, 4 -morfolina o un anillo fusionado de piperidin morfolina, mientras para la invención, existen diversas posibilidades entre la cuales se divulgan 1, 2 – morfolina o 1, 3 – morfolina.

Esta diferencia al parecer no le concede un efecto técnico inesperado o ventajosos a los compuesto de esta solicitud con respecto a lo divulgado en D1, dado que en D1 se divulgan los valores de EC₅₀ para determinar la disminución de proteína β – amiloide, responsable de la gama secretasa (D1: Folio 81 tablas 4-1 a 4-3), mientras que en esta solicitud no se cuenta con valores de actividad de inhibición de la gamma secretasa.

El Problema Técnico Objetivo que se pretende resolver es el siguiente: ¿Cómo modificar el Estado de la Técnica para obtener compuestos novedosos inhibidores de gamma secretasa?

D1 divulga de manera explícita que el anillo central es un heterociclo de 6 miembros con dos heteroátomos, donde uno es N y el otro es O. Para este caso, los heteroátomos se encuentran en posición 1 – 4 formando morfolina o 1,4 - oxazina.

Por lo tanto, una persona versada en la materia y conocedora de los conceptos de D1, sin mayor esfuerzo puede modificar el anillo heterocíclico de 6 miembros, de manera que

durante la síntesis de estos compuestos, pueda posicionar los heteroátomos de N y O, para obtener los anillos de 1, 2 – oxazina y 1, 3 – oxazina, obteniendo de esta forma los compuestos de esta invención de manera obvia o evidente.

En consecuencia, la reivindicación 1 de acuerdo a lo divulgado en D1, carece de Nivel Inventivo.

Las reivindicaciones 2 a 76 no aportan características inventivas adicionales a los compuestos de la reivindicación 1, por lo tanto, estas reivindicaciones también carecen de Nivel Inventivo.

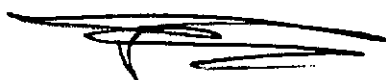
10. Conclusión

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

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	US2007117798	1 a 76	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.

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

09 OCT. 2012

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