

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 11-121527- -9	FECHA: 2013-01-31 18:27:35
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 7
ACT: 519 PRESENTACION	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
HUMBERTO RUBIO CAMACHO
MAIL@RUBIOLAWYERS.COM

Asunto: Radicación: 11-121527- -9
 Trámite: 11
 Evento: 378
 Actuación: 519
 Oficio: 1690
 Folios: 7

Patente de Invención	X			Patente de Modelo de Utilidad	
Vía Nacional					
Vía PCT (Fase Nacional)	X	Capítulo I	X	Capítulo II	
No. Solicitud Internacional	PCT/US2010/025687				
Fecha de Presentación Internacional	26/02/2010				

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 15 a 54	19/Septiembre/2011
Reivindicaciones:	Folios 55 a 58	19/Septiembre/2011
	Folios 100 a 104	19/Septiembre/2011
Prioridad:	US 61/155,791	26/Febrero/2009

2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de prioridad porque ésta 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

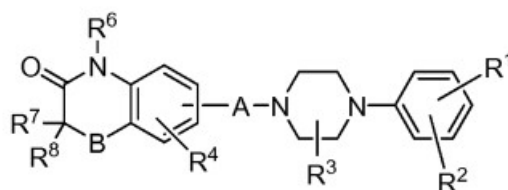
De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del Capítulo Primero del Título X de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por el solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es que cuando la solicitud contenga más de diez (10) reivindicaciones y no se haya pagado la tasa complementaria, sólo se estudiarán las cubiertas por la tasa pagada.

El presente examen se realizará sobre el total de las reivindicaciones presentadas, las cuales son 17 en total.

Título de la solicitud: “COMPOSICIONES, SÍNTESIS, Y MÉTODOS DE UTILIZACIÓN DE DERIVADOS DE ARILOPIPERAZINA”.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de obtener compuestos antipsicóticos novedosos que tengan selectividad terapéutica mejorada frente a los fármacos actuales, con el fin de que sean más eficaces y seguros para el tratamiento de la esquizofrenia y trastornos psicóticos relacionados.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona derivados de arilopiperazina de la fórmula (I) y composiciones que lo contienen.



Formula 1

El objeto de la presente solicitud se relaciona con la clasificación internacional de patentes (CIP): A61K 31/497.

4. De la solicitud de patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

En general el capítulo reivindicatorio presentado carece de claridad y concisión por cuánto se presenta una innecesaria repetición de información principalmente entre las reivindicaciones 1, 11 y 17 las cuales comparten información en su totalidad. Las fórmulas 1 y 1a son exactamente iguales, no es clara la necesidad de repetir dichas formulas con números de identificación diferentes,

Deben eliminarse de las reivindicaciones los términos ambiguos que no permiten definir la invención ni que pueda ser reproducida por el experto en la materia. Se deben eliminar las expresiones: “portador farmacéuticamente aceptable” “excipiente” “disolvente”.

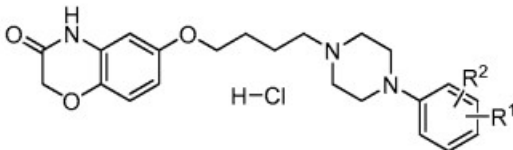
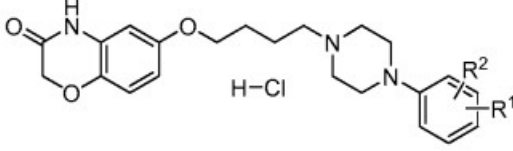
No se encuentra sustento para las modalidades “sal farmacéuticamente aceptable”, “isómero” “mezcla racémica” “mezcla diastereoisomérica”, se sugiere eliminar dichos términos del capítulo reivindicatorio.

La reivindicación 9 se caracteriza mediante resultados a alcanzar, estos deben ser eliminados ya que el compuesto de fórmula 1 se debe definir mediante características técnicas.

El capítulo reivindicatorio en general no es conciso porque contienen términos funcionales como, arilo, ariloalquilo, cicloalquilo, cicloheteroalquilo, heteroarilo, heteroariloalquilo, acilalquilooxicarbonilo, aciloxialquilooxicarbonilo, acilalquilooxicarboniloamino, aciloxialquilooxicarboniloamino, alcoxi, alcoxycarbonilo, alcoxycarboniloalcoxi, alcoxycarboniloalquiloamino, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo, alquilotio, alquiloamino, ariloalquiloamino, dialquiloamino, ariloalcoxi, ariloalcoxycarboniloalcoxi, ariloalcoxycarboniloalquiloamino, arilooxicarbonilo, ariloalcoxycarboniloalcoxi, ariloalcoxycarboniloalquiloamino, heteroariloalcoxycarbonilo, los cuales son muy generales y no permiten determinar el alcance de la invención, se sugiere sustituirlos por radicales específicos.

Las reivindicaciones 1 a 8, 10, 11, 16 y 17 no están debidamente sustentadas en la descripción porque de las definiciones de A, B, n, R1, R2, R3, R4, R5, R6, R7, y R8 se obtiene un gran número de compuestos, muchos de los cuales no demuestran la misma actividad farmacológica.

Por lo tanto, se sugiere al solicitante restringir y definir con precisión la materia a proteger, teniendo en cuenta que los compuestos para los cuales se muestra alguna actividad farmacológica son:

COMPUESTOS	ESTRUCTURA
Compuesto 15a (Ejemplo 13) (Fls. 39, 52 y 53)	 15 R1= posición 2 O-Me R2= H
Compuesto 15b (Ejemplo 14) (Fls. 39, 52 y 53)	 15 R1= posición 2 Cl R2= posición 3 Cl

5. Determinación del Estado de la Técnica

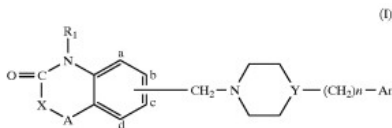
El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de prioridad: febrero 26 de 2009, y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	US5919784	"Heterocyclic aminomethyl compounds"	6/Julio/1999
D2	US2008293736	"Compositions, Synthesis, and Methods of Using Quinolinone Based Atypical Antipsychotic Agents"	27/Noviembre/2008

El documento D1¹ divulga compuestos de fórmula

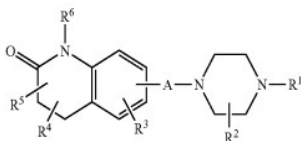
¹[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=19990706&CC=US&NR=5919784A&KC=A)

DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=19990706&CC=US&NR=5919784A&KC=A



y composiciones farmacéuticas que los contienen, los cuales son usados como ligandos del receptor D4 (Resumen, Columna 30, Reivindicaciones 1 y 2).

El documento D1² divulga compuestos derivados de quinolinona de fórmula



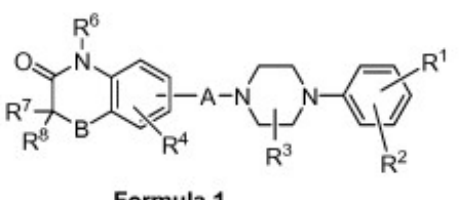
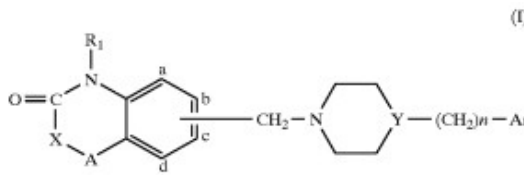
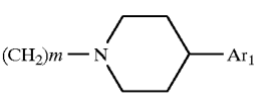
Los cuales son utilizados para el tratamiento de la esquizofrenia y psicosis relacionadas, como aguda maníaca, trastorno bipolar, autismo, y depresión. (Resumen, Columna 30, Párrafo [0098]).

6 . Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

La reivindicación 1 consiste en un compuesto de fórmula 1, con las siguientes características técnicas:

Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica (D1):

Características esenciales	D1
Compuesto de fórmula 1:	Compuesto de fórmula I: (Columna 30, Reivindicaciones 1 y 2).
 Formula 1	 (I)
A= $-(CH_2)_n$ donde $n=1$	CH ₂
B= O o S	A= O o S y X= CH ₂ y Y= N
R ₁ , R ₂ , R ₃ , R ₄ , R ₆ , R ₇ , R ₈ = H, alquilo, arilo, ariloalquilo, cicloalquilo, cicloheteroalquilo, heteroarilo, heteroariloalquilo, acilalquilooxicarbonilo, aciloxialquilooxicarbonilo, acilalquilooxicarboniloamino, aciloxialquilooxicarboniloamino, alcoxi, alcoxycarbonilo, alcoxycarboniloalcoxi, , alcoxycarboniloalquiloamino, alquilsulfínilo, alquilsulfonilo, alquilotio, alquiloamino, ariloalquiloamino, dialquiloamino, ariloalcoxi, ariloalcoxycarboniloalcoxi, ariloalcoxycarboniloalquiloamino,	Ar= piridilo, pirimidilo, benzotiazol, fenilo o naftilo opcionalmente sustituido con uno dos o tres grupos halógeno, OH, aluilo entre otros. R ₁ = H, alquilo, 

²<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?>

DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20081127&CC=US&NR=2008293736A1&KC=A1

arilooxicarbonilo, ariloxicarboniloalcoxi, ariloxicarboniloalquiloamino, heteroarilooxicarbonilo	donde Ar1 puede ser CO-Ar2, donde Ar2 puede ser fenilo opcionalmente sustituido.
--	---

Las características esenciales del compuesto de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en el documento D1, el cual tiene características técnicas que se traslapan con las de la presente invención, tal y como se muestra en la tabla anterior.

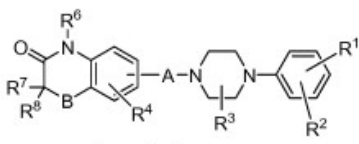
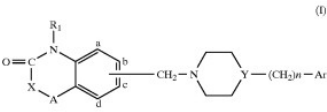
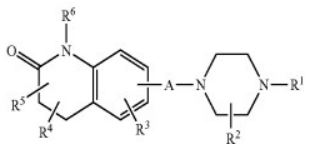
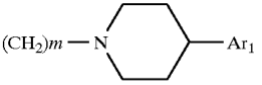
En consecuencia, la reivindicación 1 no es nueva o carece de novedad, según lo divulgado en el documento D1.

Las reivindicaciones 2, 3, 6 a 8, 10, 11, 16 y 17 no mencionan alguna característica que haga nueva a la composición de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.

Nivel inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 4 consiste en el compuesto de fórmula 1 de la reivindicación 1, en donde:

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

Características esenciales	D1	D2
Compuesto de fórmula 1:	Compuesto de fórmula I: (Columna 30, Reivindicaciones 1 y 2).	Compuesto de fórmula I: (Párrafo [0098]).
 Formula 1	 (I)	
A= -O-(CH2)n, S(CH2)n, CH2-O- (CH2)n, (CH2)n-O-CH2-CH2-, CH2-S-(CH2)n O -(CH2)n-S-CH2- CH2-	Únicamente CH2	A= O-(CH2)n, S(CH2)n, CH2-O-(CH2)n, (CH2)n-O- CH2-CH2-, CH2-S-(CH2)n O -(CH2)n-S-CH2-CH2-
Donde n= entero 1 a 7		
B= O o S	A= O o S y X= CH2 y Y= N	
R1, R2, R3, R4, R6, R7, R8= H, alquilo, arilo, ariloalquilo, cicloalquilo, cicloheteroalquilo, heteroarilo, heteroariloalquilo, acilalquilooxicarbonilo, aciloxialquilooxicarbonilo, acilalquilooxicarboniloamino, aciloxialquilooxicarboniloamino, alcoxi, alcoxycarbonilo, alcoxycarboniloalcoxi, , alcoxycarboniloalquiloamino, alquilsulfonilo, alquilosulfonilo, alquilotio, alquiloamino, ariloalquiloamino, dialquiloamino, ariloalcoxi, ariloalcoxycarboniloalcoxi, ariloalcoxycarboniloalquiloamino, arilooxicarbonilo, arilooxicarboniloalcoxi, arilooxicarboniloalquiloamino, heteroarilooxicarbonilo	Ar= piridilo, pirimidilo, benzotiazol, fenilo o naftilo opcionalmente sustituido con uno dos o tres grupos halógeno, OH, aluilo entre otros. R1= H, alquilo,  donde Ar1 puede ser CO- Ar2, donde Ar2 puede ser fenilo opcionalmente sustituido.	R1, R2, R3, R4, R6, R7, R8= H, alquilo, arilo, ariloalquilo, cicloalquilo, cicloheteroalquilo, heteroarilo, heteroariloalquilo, acilalquilooxicarbonilo, aciloxialquilooxicarbonilo, acilalquilooxicarboniloamino, aciloxialquilooxicarboniloami no, alcoxi, alcoxycarbonilo, alcoxycarboniloalcoxi, , alcoxycarboniloalquiloamino, alquilsulfonilo, alquilosulfonilo, alquilotio, alquiloamino, ariloalquiloamino, dialquiloamino, ariloalcoxi, ariloalcoxycarboniloalcoxi, ariloalcoxycarboniloalquiloami no, arilooxicarbonilo, arilooxicarboniloalcoxi, arilooxicarboniloalquiloamino, heteroarilooxicarbonilo

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 4 porque divulga compuestos de fórmula I y composiciones farmacéuticas que los contienen, los cuales son usados como ligandos del receptor D4 para el tratamiento de trastornos como la ansiedad y la depresión (Columna 30, Reivindicaciones 1, 2 y 9)

La diferencia entre los compuestos definidos en la reivindicación 4 y los divulgados en el documento D1 consiste en que A puede ser -O-(CH2)n, S(CH2)n, CH2-O-(CH2)n, (CH2)n-O-CH2-CH2-, CH2-S-(CH2)n O -(CH2)n-S-CH2-CH2-.

No se observa ningún efecto sorprendente como consecuencia de dicha diferencia en la definición de A. Los resultados de actividad presentados no permiten realizar una comparación que pueda determinar que los compuestos de la invención son selectivos por D2s, por lo tanto la ausencia de datos no significa que los compuestos de D1 no tengan dicha selectividad.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo obtener compuestos alternativos a los conocidos en el documento D1 para el tratamiento de la esquizofrenia y trastornos psicóticos relacionados”.

Sin embargo, el documento D2 enseña compuestos derivados de quinolinona (Fórmula I) los cuales son utilizados para el tratamiento de la esquizofrenia y psicosis relacionadas, como aguda maníaca, trastorno bipolar, autismo, y depresión. En el documento D2 A se define como O-(CH2)n, S(CH2)n, CH2-O-(CH2)n, (CH2)n-O-CH2-CH2-, CH2-S-(CH2)n O -(CH2)n-S-CH2-CH2- (Resumen, Columna 30, Párrafo [0098]).

En consecuencia, una persona del oficio normalmente versada en la materia, que conoce las anterioridades mencionadas estaría motivada a sustituir el grupo CH2 de D1, por un grupo definido como A en esta misma posición para los compuestos del documento D2, con la expectativa razonable de obtener compuestos alternativos que puedan ser utilizados en el tratamiento de esquizofrenia y trastornos psicóticos relacionados llegando así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud, por lo cual se considera obvia.

La reivindicación 4 cumple el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18). La reivindicación 5 no tienen características técnicas adicionales por lo tanto se considera que no es inventiva.

7. Conclusión

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

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	US5919784	1 – 3, 6 a 8, 10- 17	Novedad
		4 y 5	Nivel inventivo
	US5919784	4 y 5	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.

Se invita al solicitante se sirva indicar, si así lo considera, su renuncia al término faltante de sesenta (60) días para dar respuesta a este requerimiento y presentarla por escrito.

Finalmente, se le recuerda al solicitante que si como respuesta a este requerimiento llegara a modificar el capítulo reivindicatorio y éste contenga más de diez (10) reivindicaciones, no pagará la tasa de modificación voluntaria pero sí la correspondiente al pago por reivindicación adicional.

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.



JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ
Director de Nuevas Creaciones (c)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 2013-02-05

Elaboró: Ximena Isabel Andrade Hermoso
Revisó: Consuelo Leguizamon Leguizamon