

**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

**RESOLUCIÓN No:62673**

*Por la cual se deniega una patente de invención*

Rad/PCT : 11-121527

**EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las conferidas en el numeral 26 del artículo 3° del Decreto 4886 de 2011, y

**CONSIDERANDO:**

**PRIMERO:** Que mediante escrito radicado en esta Superintendencia el 19 de Septiembre de 2011, con el N° 11-121527-00000-0000, por la(s) sociedad(es) Reviva Pharmaceuticals, Inc., entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "COMPOSICIONES, SÍNTESIS, Y MÉTODOS DE UTILIZACIÓN DE DERIVADOS DE ARILOPIPERAZINA", que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2010/025687 del 26 de febrero de 2010.

**SEGUNDO:** Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 643 del 30 de abril de diciembre de 2012, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

**TERCERO:** Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 1690 y notificado por fijación en lista el 05 de febrero de 2013 se requirió a la solicitante en los términos del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, para que presentara respuesta a las observaciones de carácter técnico, relacionadas con la patentabilidad o cumplimiento de los requisitos establecidos por esta Decisión para la concesión de la patente.

**CUARTO:** Que el solicitante mediante dos escritos radicados bajo N° 11-121527-00011-0000 del 12 de junio de 2013 y N° 11-121527-00012-0000 del 13 de junio de 2013, respondió oportunamente el requerimiento formulado, y presentó nueva(s) reivindicación(es) 1 a 11 que reemplaza(n) las originalmente presentadas, atendiendo de esta manera las observaciones efectuadas en el examen de fondo. Se acepta el último capítulo reivindicatorio presentado bajo radicado N° 11-121527-00012-0000 del 13 de junio de 2013, comoquiera que se ajusta a las prescripciones contenidas en el artículo 34 de la Decisión 486.

**QUINTO:** Que de acuerdo con el objeto de la solicitud presentada, se modifica el título de la invención, el cual quedará de la siguiente manera: "DERIVADOS DE ARILOPIPERAZINA MODULADORES DE LOS RECEPTORES DE DOPAMINA-2 Y SEROTONINA-1A".

**SEXTO:** Que en virtud de lo dispuesto en el artículo 14 de la Decisión 486 expedida por la Comisión de la Comunidad Andina *"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."*

**SÉPTIMO:** Que las reivindicaciones 1 a 11, no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

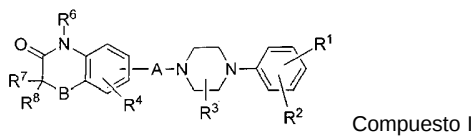
**7.1. Objeto de la invención.**

El problema planteado en esta solicitud es proporcionar compuestos útiles para el tratamiento farmacológico de la esquizofrenia, psicosis y otras patologías del SNC. Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de la fórmula (I) y composiciones que lo contienen.

**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

**RESOLUCIÓN No:62673**  
*Por la cual se deniega una patente de invención*

Rad/PCT : 11-121527



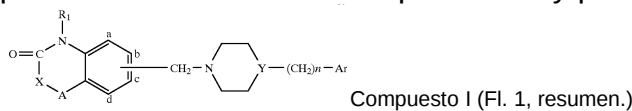
**7.2. Determinación del estado de la técnica.**

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 26 de febrero de 2009, que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de cual se invoca prioridad.

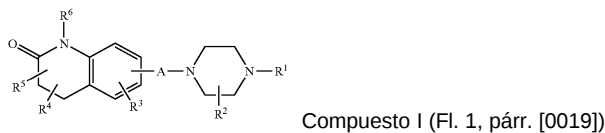
Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

| Ítem | Documento     | Título                                                                                          | Fecha de Publicación* |
|------|---------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------|
| D1   | US5919784     | “ Heterocyclic aminomethyl compounds”                                                           | 6/Julio/1999          |
| D2   | US2008/293736 | “Compositions, Synthesis, and Methods of Using Quinolinone Based Atypical Antipsychotic Agents” | 27/Noviembre/2008     |

El documento D1<sup>[1]</sup> divulga compuestos de fórmula (I) y las composiciones farmacéuticas que los contienen útiles para el tratamiento de la esquizofrenia y psicosis.

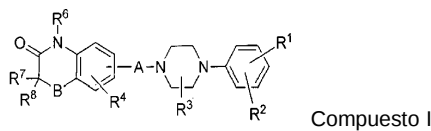


El documento D2<sup>[2]</sup> divulga compuestos de fórmula (I) y las composiciones farmacéuticas que los contienen útiles para el tratamiento de la esquizofrenia.



Según lo dispuesto en el artículo 18 de la Decisión 486: “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”.

En el presente caso, los compuestos reclamados en la solicitud no tienen nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 define: “Un compuesto de fórmula (I)” (Pág. 8 del radicado No 11-121527-00012-0000)



La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la reivindicación 1, y las reveladas en el (los) documento(s) D1 y D2 que representa(n) el estado de la técnica.

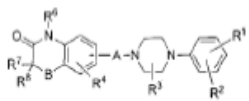
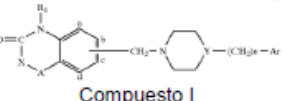
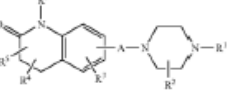
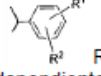
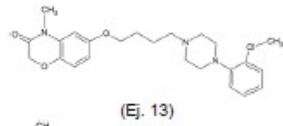
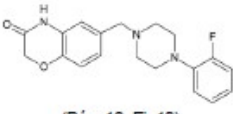
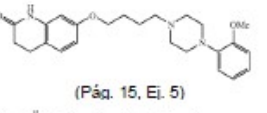
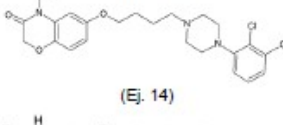
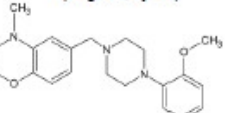
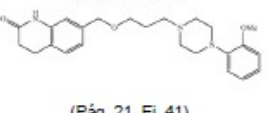
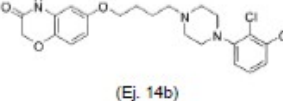
1: <https://www.google.com/patents/US5919784>  
2: [http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=US&NR=2008293736&KC=&FT=E&locale=en\\_EP](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=US&NR=2008293736&KC=&FT=E&locale=en_EP)

REPÚBLICA DE COLOMBIA  
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:62673  
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad/PCT : 11-121527

Tabla 1

| Características esenciales                                                                                                                                                                                                                                                         | D1                                                                                                                                                             | D2                                                                                                                                                                                                                                           |
|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| Un compuesto de fórmula (I)<br><br>Compuesto I                                                                                                                                                    | Un compuesto de fórmula (I)<br><br>Compuesto I<br>(Pág. 16, reivindicación 1) | Un compuesto de fórmula (I)<br><br>Compuesto I<br>(Págs. 3 y 4, Párrs. [0019-0022])                                                                       |
| A<br>O-(CH2)n-S-(CH2)n-, -CH2-O-(CH2)n-, -(CH2)n-O-CH2-CH2-, -CH2-S-(CH2)n-, -(CH2)n-S-CH2-CH2-, -O-(CH2)n-, -S-(CH2)n-, -CH2-O-(CH2)n-, -(CH2)n-O-CH2-CH2-, -CH2-S-(CH2)n-, ó -(CH2)n-S-CH2-CH2- en donde n es un número entero entre 1 y 7                                       | CH2<br><br>metil<br>etil<br>(Pág. 17, reivindicación 3)                                                                                                        | A<br>O-(CH2)n-S-(CH2)n-, -CH2-O-(CH2)n-, -(CH2)n-O-CH2-CH2-, -CH2-S-(CH2)n-, -(CH2)n-S-CH2-CH2-, -O-(CH2)n-, -S-(CH2)n-, -CH2-O-(CH2)n-, -(CH2)n-O-CH2-CH2-, -CH2-S-(CH2)n-, ó -(CH2)n-S-CH2-CH2- en donde n es un número entero entre 1 y 7 |
| B<br>O ó S                                                                                                                                                                                                                                                                         | A<br>O ó S                                                                                                                                                     | Carbono                                                                                                                                                                                                                                      |
| <br>R1 y R2 son es independiente alquilo, alcoxi ó halógeno, en donde dicho alquilo es metanilo, etanilo, propanil. o butanilo y dicho alcoxi es metoxi, toxi, propoxi, butoxi o ciclohexiloxi. | (CH2)n-Ar<br><br>donde n es 0 y Ar representa fenilo o fenilo sustituido con alquilo inferior, alcoxi inferior y halógeno.                                     | R1<br><br>arilo o arilo sustituido                                                                                                                                                                                                           |
| R3<br>hidrógeno, alquilo, alcoxi ó halógeno.                                                                                                                                                                                                                                       | hidrógeno                                                                                                                                                      | R4<br>hidrógeno, alquilo, alcoxi ó haló.                                                                                                                                                                                                     |
| R4<br>hidrógeno, alquilo, alcoxi ó halógeno                                                                                                                                                                                                                                        | hidrógeno                                                                                                                                                      | R5<br>hidrógeno, alquilo, alcoxi ó haló.                                                                                                                                                                                                     |
| R5<br>hidrógeno, alquilo, alcoxi ó halógeno                                                                                                                                                                                                                                        | R1<br>hidrógeno ó alquilo inferior,                                                                                                                            | R6<br>hidrógeno, alquilo, alcoxi ó haló.                                                                                                                                                                                                     |
| R7<br>hidrógeno, alquilo, alcoxi ó halógeno                                                                                                                                                                                                                                        | hidrógeno                                                                                                                                                      | R4<br>hidrógeno, alquilo, alcoxi ó haló.                                                                                                                                                                                                     |
| R8<br>hidrógeno, alquilo, alcoxi ó halógeno                                                                                                                                                                                                                                        | hidrógeno                                                                                                                                                      | R5<br>hidrógeno, alquilo, alcoxi ó haló.                                                                                                                                                                                                     |
| Realizaciones preferidas                                                                                                                                                                                                                                                           | Ejemplos                                                                                                                                                       | Ejemplos                                                                                                                                                                                                                                     |
| <br>(Ej. 13)                                                                                                                                                                                    | <br>(Pág. 12, Ej. 10)                                                       | <br>(Pág. 15, Ej. 5)                                                                                                                                    |
| <br>(Ej. 14)                                                                                                                                                                                    | <br>(Pág. 10, Ej. 7)                                                        | <br>(Pág. 21, Ej. 41)                                                                                                                                   |
| <br>(Ej. 14b)                                                                                                                                                                                   |                                                                                                                                                                |                                                                                                                                                                                                                                              |

El documento D2 se considera el estado de la técnica cercano a la materia reclamada definida en las reivindicaciones 1 y 9 porque divulga compuestos de fórmula (I) y las

**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

**RESOLUCIÓN No:62673**

*Por la cual se deniega una patente de invención*

Rad/PCT : 11-121527

composiciones farmacéuticas que lo contienen útiles para el tratamiento de la esquizofrenia (Fl. 1, párr. [0019]).

La diferencia entre la materia reclamada, definida en las reivindicaciones 1 y 9 y los compuesto del documento D2 consiste en que los compuestos de la solicitud comprenden un heterobiciclo ejemplificado por un grupo benzo[b]1,4]oxazin-3(4H)-ona mientras que el documento D2 divulga el anillo heterobiciclo representado por un grupo 3,4-dihidroquinolin-2(1H)-ona.

El efecto que logra el sustituir el anillo 3,4-dihidroquinolin-2(1H)-ona por un grupo benzo[b]1,4]oxazin-3(4H)-ona es obtener nuevos compuestos útiles para el tratamiento farmacológico de la esquizofrenia, psicosis y otras patologías del Sistema Nervioso Central.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta solicitud se puede formular así: cómo obtener compuestos alternativos útiles para el tratamiento farmacológico de la esquizofrenia, psicosis y otras patologías del Sistema Nervioso Central.

Sin embargo, el documento D1 divulga que compuestos que presentan un grupo benzo[b]1,4]oxazin-3(4H)-ona son útiles para el tratamiento de la esquizofrenia.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, estaría motivada a sustituir el grupo 3,4-dihidroquinolin-2(1H)-ona de los compuestos divulgados en el documento D2 por una serie bioisómera como el grupo benzo[b]1,4]oxazin-3(4H)-ona dado que los dos grupos muestran ser útiles para el tratamiento de la esquizofrenia como lo revela el documento D1. Por lo cual la materia reclamada en las reivindicaciones 1 y 9 de la solicitud se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 a 8, 10 y 11 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

En referencia a los argumentos del solicitante según los cuales los compuestos reclamados son una selección de los compuestos del estado de la técnica, y el espaciador entre los dos anillos centrales en el documento D1 es apolar y por lo tanto los compuestos de la solicitud son muy diferentes, este Despacho aclara a la solicitante que el compuesto 14 de la solicitud es menos activo sobre los receptores dopaminérgicos que el compuesto más cercano en el estado de la técnica denominado aripiprazol y este a su vez menos potente que el compuesto 41 divulgado por el documento D2, lo anterior de acuerdo con los resultados de estudios de la relación estructura-actividad divulgados en otros documentos del arte previo<sup>[3]</sup><sup>[4]</sup>. Adicionalmente, no se presenta ninguna evidencia técnica que permita concluir que el compuesto reclamado es más selectivo por receptores específicos identificados como útiles para el tratamiento de la esquizofrenia o que presente menores efectos adversos como era el objeto técnico planteado en la solicitud. Por lo tanto, la sustitución sobre el anillo 3,4-dihidroquinolin-2(1H)-ona en los compuestos divulgados en el documento D2 de un átomo de carbono por un átomo de oxígeno o azufre como lo sugiere el documento D1 para obtener compuestos alternativos derivados de la benzo[b]1,4]oxazin-3(4H)-ona no lo confiere un efecto técnico inesperado o sorprendente a la solicitud y el carácter polar o apolar del

3: <http://link.springer.com/article/10.1007%2Fs00706-007-0782-3#page-1>; Pág 422, tabla 5.

4 <http://www.sciencedirect.com/science/article/pii/S0968089606003890> Pág 5899, Esquema 1.

**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

**RESOLUCIÓN No:62673**

*Por la cual se deniega una patente de invención*

Rad/PCT : 11-121527

conector no tiene un efecto crítico o relevante sobre la actividad farmacológica de los compuestos como lo afirma la solicitante.

En conclusión, teniendo en cuenta que los argumentos de la solicitante no desvirtúan de manera alguna las objeciones a la patentabilidad ya sustentada, el Superintendente de Industria y Comercio,

**RESUELVE:**

**ARTÍCULO PRIMERO:** Denegar la patente de invención a la creación titulada “DERIVADOS DE ARILOPIPERAZINA AGONISTA DE LOS RECEPTORES DE DOPAMINA-2 Y SEROTONINA-1A”.

**ARTÍCULO SEGUNDO:** Notificar el contenido de la presente resolución a la(s) sociedad(es) Reviva Pharmaceuticals, Inc., entregándole(s) copia de la misma y advirtiéndole(s) que contra ella procede el recurso de reposición, ante el Superintendente de Industria y Comercio, el cual podrá ser interpuesto en el momento de la notificación o dentro de los cinco (5) días hábiles siguientes a ella.

**NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE**

Dada en Bogotá D.C., el 28 Oct 2013

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



**PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO**

Doctor(a)  
HUMBERTO RUBIO CAMACHO  
hrubio@rubiolawyers.com

Elaboró: Lenin Roberto Guerrero  
Revisó: Jeny Paola Villate Becerra  
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez  
Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez