

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-001282-00005-0000

Fecha: 2009-11-09 16:49:41 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 7

1

As. 100.026

Señora

JEFE DE DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

E.

S.

D.

REF: Expediente No. 06 001 282 – solicitud de patente de invención a favor de NEUROSEARCH A/S.

Respuesta al oficio No. 9365 del 14 de agosto de 2009

CARLOS HUMBERTO PALACIO EASTMAN, portador de la tarjeta profesional No. 62154 del C.S.J., obrando como apoderado sustituto de la sociedad NEUROSEARCH A/S, según lo acredita el documento de sustitución de poder presentado ante esa División, me permito dar respuesta a las observaciones de carácter técnico y jurídico, relacionadas con la patentabilidad, para la concesión de la patente de acuerdo con la Decisión 486 según el concepto técnico No. 02631 notificado por fijación en lista de fecha 14 de agosto de 2009.

En primer lugar, nos permitimos adjuntar un nuevo capítulo reivindicatorio de 1-8 Reivindicaciones que subsana las objeciones hechas por el Señor Examinador. En este capítulo fueron eliminados los usos y métodos de tratamiento sin ampliar en ningún momento la materia inicialmente divulgada y encontrando entero sustento en la descripción.

Asimismo, respetuosamente discrepamos de la opinión del Señor Examinador en cuanto a la carencia de Novedad de la presente solicitud, a

partir del documento D1 (WO 97/30997), para lo cual se presentan los siguientes argumentos.

En relación a la novedad de la presente solicitud, es preciso indicar que los compuestos y sales reivindicadas en la presente invención son completamente nuevos a los revelados en el arte previo. Realizando una comparación exhaustiva de los dos documentos, es claro que ninguno de los compuestos revelados en D1 corresponde a la fórmula exacta de ninguno de los compuestos reivindicados en la presente invención. De acuerdo con lo anterior, el diseño estructural de los compuestos es diferente a la de los expuestos en D1, por lo que consideramos que la presente solicitud es novedosa frente al arte previo conocido. Por esta razón, ponemos en consideración del Señor Examinador el retiro de sus objeciones a la novedad, haciendo énfasis en que esta solo puede verse afectada en caso que la composición sea exactamente la misma.

Teniendo en cuenta la novedad evidente y anticipándonos al nivel inventivo de la presente solicitud sobre el arte previo, es preciso indicar lo siguiente. En particular, ninguno de los compuestos específicos en D1 se formula como una sal de tartrato; es más, D1 sugiere muchas otras posibilidades por lo que un técnico entrenado en la materia no estaría motivado en ningún momento a escoger las sales de tartrato de manera preferencial. Adicionalmente, D1 menciona únicamente que los tartratos pueden ser utilizados para la cristalización de mezclas racémicas, pero no menciona o sugiere nada sobre las propiedades farmacéuticas de dichas sales. De acuerdo con esto, no se indica o sugiere en ningún momento en el arte previo que estas sales concedan un efecto técnico superior al mejorar las propiedades de los compuestos, como por ejemplo la no higroscopicidad de los mismos. El lograr compuestos con propiedades mejoradas constituye un aporte importante al estado de la técnica, dada su aplicación industrial y comercial por lo que la presente invención puede catalogarse como nueva e inventiva.

Con el fin de dar un mayor soporte a los argumentos presentados, se anexa un estudio comparativo realizado para analizar las diferencias en

propiedades, como la higroscopicidad, entre las sales de tartrato de la presente solicitud y la sal de citrato ilustrada en el ejemplo 15 de D1. Es claro al observar este estudio que la sal de tartrato reivindicada no es higroscópica en comparación con la sal de citrato del arte previo. Por esta razón, se puede inferir que los compuestos que hacen parte de la presente invención proporcionan la solución a un problema técnico real, y conceden un efecto técnico inesperado.

En conclusión, con los argumentos presentados, consideramos que la cumple con los requisitos de novedad y nivel inventivo, además todos los demás requisitos establecidos en la decisión 486 para ser clasificada como patentable. Por esta razón, respetuosamente solicitamos el retiro de las objeciones realizadas por el Señor Examinador.

De la señora Jefe,



CARLOS HUMBERTO PALACIO EASTMAN

C.C. No. 79.311.882 de Bogotá

T.P. No. 62154 del C.S.J.

Calle 70A No. 4-41

Bogotá, 9 de noviembre de 2009

MXB/NFA

Anexo

5/12

REIVINDICACIONES

- 1. Una sal seleccionada de las formas anhidra e hidratada de tartrato de (1R, 2R, 3S, 5S)-2-metoximetil-3-(3,4-diclorofenil)-8-azabicyclo [3.2.1] octano.
- 2. La sal de la reivindicación 1 seleccionada de las formas anhídrida e hidratada de L-tartrato de (1R, 2R, 3S, 5S)-2-metoximetil-3-(4,3-diclorofenil)-8-azabicyclo[3.2.1] octano.
- 3. La sal de la reivindicación 1, que es monohidrato de L-tartrato de (1R, 2R, 3S, 5S)-2-metoximetil-3-(4,3-diclorofenil)-8-azabicyclo[3.2.1] octano.
- 4. La sal de la reivindicación 1, que es una forma anhídrida de L-tartrato de (1R, 2R, 3S, 5S)-2-metoximetil-3-(4,3-diclorofenil)-8-azabicyclo[3.2.1] octano.
- 5. La sal de la reivindicación 4, que es una forma polimórfica (forma II) de anhídrido de L-tartrato de (1R, 2R, 3S, 5S)-2-metoximetil-3-(4,3-diclorofenil)-8-azabicyclo[3.2.1] octano caracterizada por los siguientes picos principales en el patrón de difracción de rayos X del polvo:

Pico N°	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10
2Theta°(Cu Kα)	10,35	11,68	12,53	14,81	15	15,77	16,82	17,41	17,77	18,87
espacio d (A)	8,5	7,6	7,1	6,0	5,9	5,6	5,3	5,1	5,0	4,7
Pico	11	12	13	14	15	16	17	18	19	
2Theta°(Cu Kα)	20,29	21,26	21,66	23,44	23,73	25,44	25,99	27,58	28,14	
espacio d (A)	4,4	4,2	4,1	3,8	3,7	3,5	3,4	3,2	3,2	

- 6. La sal de la reivindicación 4, que es una forma polimórfica (forma III) del anhídrido del L-tartrato de (1R, 2R, 3S, 5S)-2-metoximetil-3-(4,3-diclorofenil)-8-azabicyclo[3.2.1] octano caracterizada por los siguientes picos en el patrón de difracción de rayos X del polvo:

Pico N°	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10
2Theta°(Cu Kα)	5,37	10,6	10,82	11,58	11,88	12,79	14,78	16,57	16,5	17,03
espacio d (A)	16,4	8,3	8,2	7,6	7,4	6,9	6,0	5,4	5,4	5,2
Pico	11	12	13	14	15	16	17	18	19	
2Theta°(Cu Kα)	17,84	19,29	20,01	21,2	22,99	23,46	24,54	25,15	26,59	
espacio d (A)	5,0	4,6	4,4	4,2	3,9	3,8	3,6	3,5	3,3	

7. La sal de la reivindicación 4, que es una forma polimórfica (forma IV) del L-tartrato de (1R, 2R, 3S, 5S)-2-metoximetil-3-(4,3-diclorofenil)-8-azabicyclo[3.2.1] octano caracterizada por los siguientes picos en el patrón de difracción de rayos X del polvo:

Pico N°	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10
2Theta°(Cu Kα)	5,31	10,19	11,23	12,13	12,35	12,69	14,31	14,55	14,77	16,43
espacio d (A)	16,6	8,7	7,9	7,3	7,2	7,0	6,2	6,1	6,0	5,4
Pico	11	12	13	14	15	16	17	18	19	20
2Theta°(Cu Kα)	17,48	18,21	18,43	18,81	19,36	19,61	20,26	20,5	21,29	21,46
espacio d (A)	5,1	4,9	4,8	4,7	4,6	4,5	4,4	4,3	4,2	4,1
Pico	21	22	23	24	25	26	27	28	29	30
2Theta°(Cu Kα)	21,59	22,53	22,77	23,38	23,59	23,9	24,45	25,02	25,56	26,19
espacio d (A)	4,0	3,9	3,9	3,8	3,8	3,7	3,6	3,6	3,5	3,4
Pico	31	32								
2Theta°(Cu Kα)	26,83	27,21								
espacio d (A)	3,3	3,3								

8. Una composición farmacéutica que comprende una cantidad terapéuticamente efectiva de una sal de cualquiera de las reivindicaciones 1 – 7, junto con al menos un portador, excipiente o diluyente farmacéuticamente aceptable.

ANEXO

Exhibit I

Hygroscopicity as measured by Dynamic Vapour Sorption (DVS)

The citrate salt and the L-tartrate salt (monohydrate) of (1R,2R,3S,5S)-2-methoxymethyl-3-(3,4-dichlorophenyl)-8-azabicyclo[3.2.1]octane were tested for their water sorption characteristics as a function of increasing and decreasing humidity.

The sample weight was taken as the dry weight after equilibration at 0%RH (relative humidity). The adsorption cycles were sequentially stepped at 10% intervals from 0% to 95%RH. The desorption cycle was the reverse of the adsorption cycle and was sequential after the adsorption cycle. A second adsorption-desorption cycle was also sequentially performed.

Citrate salt

The DSV sorption profile for the citrate salt is shown in Figure 1. The profile shows the salt to be hygroscopic. The mass increase of up to 3% at ambient relative humidity indicates the formation of a monohydrate. At high relative humidity the mass increase is 15% or more. When decreasing the relative humidity, the salt keeps about 5 % mass increase.

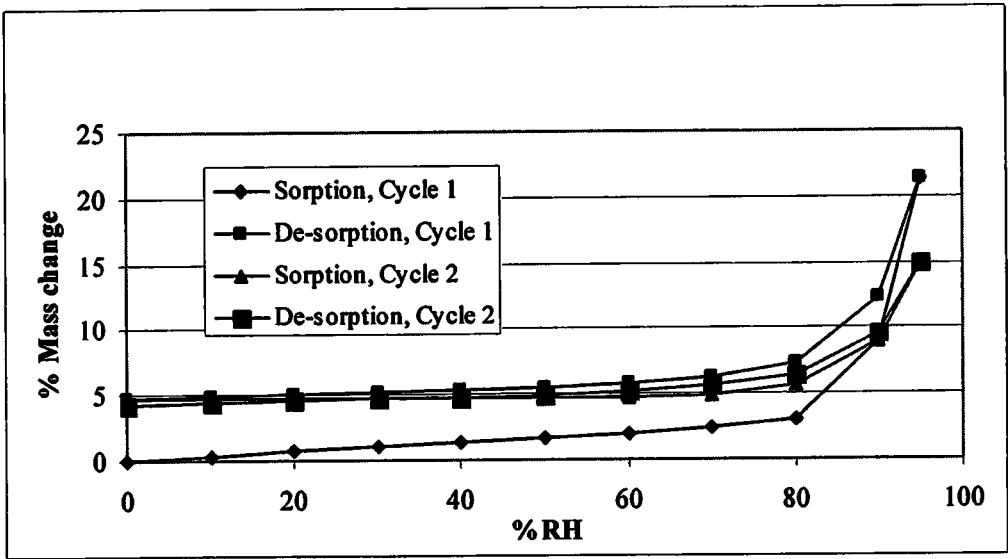


Figure 1. DSV sorption profile of the citrate salt.

PCT

WORLD INTELLECTUAL PROPERTY ORGANIZATION
International Bureau



19

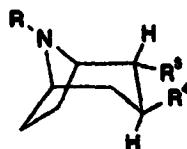
INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(51) International Patent Classification ⁶ : C07D 451/02, A61K 31/46		A1	(11) International Publication Number: WO 97/30997
			(43) International Publication Date: 28 August 1997 (28.08.97)
(21) International Application Number: PCT/EP97/00850		(81) Designated States: AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GE, HU, IL, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ARIPO patent (KE, LS, MW, SD, SZ, UG), Eurasian patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG).	
(22) International Filing Date: 21 February 1997 (21.02.97)		Published <i>With international search report.</i> <i>Before the expiration of the time limit for amending the claims and to be republished in the event of the receipt of amendments.</i>	
(30) Priority Data: 0194/96 22 February 1996 (22.02.96) DK			
(71) Applicant (for all designated States except US): NEUROSEARCH A/S [DK/DK]; Smedeland 26B, DK-2600 Glostrup (DK).			
(72) Inventors; and (75) Inventors/Applicants (for US only): SCHEEL-KRÜGER, Jørgen [DK/DK]; Ejbydalsvej 127, DK-2600 Glostrup (DK). MOLDT, Peter [DK/DK]; Langebjergvej 355, DK-3050 Humlebaek (DK). WÄTJEN, Frank [DK/DK]; Afaldet 22, DK-2730 Herlev (DK).			
(74) Agent: GRÜNECKER, KINKELDEY, STOCKMAIR & SCHWANHÄUSSER; Maximilianstrasse 58, D-80538 München (DE).			

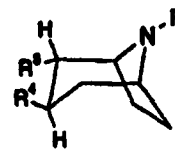
(54) Title: TROPANE-DERIVATIVES, THEIR PREPARATION AND USE

(57) Abstract

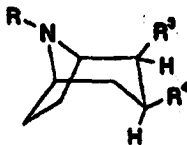
The present invention discloses compounds of formula (a), (b), (c) or (d), or any mixture thereof, or a pharmaceutically acceptable salt thereof; wherein R is hydrogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl, cycloalkylalkyl or 2-hydroxyethyl; R³ is -CH₂-X-R', wherein X is O, S or NR'', wherein R'' is hydrogen, or alkyl and R' is alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl, cycloalkylalkyl, or -CO-alkyl; R⁴ is phenyl which may be substituted one or more times with substituents selected from the group consisting of halogen, CF₃, CN, alkoxy, cycloalkoxy, alkyl, cycloalkyl,



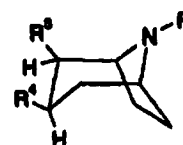
(a)



(b)



(c)



(d)

alkenyl, alkynyl, amino, nitro, heteroaryl and aryl; 3,4-methylenedioxyphenyl; benzyl which may be substituted one or more times with substituents selected from the group consisting of halogen, CF₃, CN, alkoxy, cycloalkoxy, alkyl, cycloalkyl, alkenyl, alkynyl, amino, nitro, heteroaryl and aryl; heteroaryl which may be substituted one or more times with substituents selected from the group consisting of halogen, CF₃, CN, alkoxy, cycloalkoxy, alkyl, cycloalkyl, alkenyl, alkynyl, amino, nitro, heteroaryl and aryl; or naphthyl which may be substituted one or more times with substituents selected from the group consisting of halogen, CF₃, CN, alkoxy, cycloalkoxy, alkyl, cycloalkyl, alkenyl, alkynyl, amino, nitro, heteroaryl and aryl. The compounds possess valuable pharmaceutical properties as monoamine neurotransmitter, i.e. dopamine, serotonin, noradrenaline, reuptake inhibitors.

Amino is NH_2 or NH-alkyl or N-(alkyl)_2 , wherein alkyl is as defined above.

Heteroaryl is a 5- or 6-membered heterocyclic monocyclic group. Such an heteroaryl group includes, for example, oxazol-2-yl, oxazol-4-yl, oxazol-5-yl, isoxazol-3-yl, isoxazol-4-yl, isoxazol-5-yl, thiazol-2-yl, thiazol-4-yl, thiazol-5-yl, isothiazol-3-yl, isothiazol-4-yl, isothiazol-5-yl, 1,2,4-oxadiazol-3-yl, 1,2,4-oxadiazol-5-yl, 1,2,4-thiadiazol-3-yl, 1,2,4-thiadiazol-5-yl, 1,2,5-oxadiazol-3-yl, 1,2,5-oxadiazol-4-yl, 1,2,5-thiadiazol-3-yl, 1,2,5-thiadiazol-4-yl, 1-imidazolyl, 2-imidazolyl, 4-imidazolyl, 1-pyrrolyl, 2-pyrrolyl, 3-pyrrolyl, 2-furanyl, 3-furanyl, 2-thienyl, 3-thienyl, 2-pyridyl, 3-pyridyl, 4-pyridyl, 2-pyrimidinyl, 4-pyrimidinyl, 5-pyrimidinyl, 3-pyridazinyl, 4-pyridazinyl, 2-pyrazinyl and 3-pyrazinyl and 1-pyrazolyl, 3-pyrazolyl, and 4-pyrazolyl.

Aryl is an aromatic hydrocarbon, such as phenyl and naphthyl.

Further, the compounds of this invention may exist in unsolvated as well as in solvated forms with pharmaceutically acceptable solvents such as water, ethanol and the like. In general, the solvated forms are considered equivalent to the unsolvated forms for the purposes of this invention.

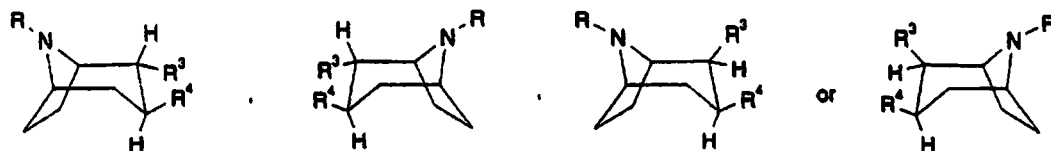
✓ It will be appreciated by those skilled in the art that the compounds of the present invention contain several chiral centres and that such compounds exist in the form of isomers (i.e. enantiomers). The invention includes all such isomers and any mixtures thereof including racemic mixtures.

✓ Racemic forms can be resolved into the optical antipodes by known methods, for example, by separation of diastereomeric salts thereof with an optically active acid, and liberating the optically active amine compound by treatment with a base. Another method for resolving racemates into the optical antipodes is based upon chromatography on an optically active matrix. Racemic compounds of the present invention can thus be resolved into their optical antipodes, e.g., by fractional crystallization of d- or l- (tartrates, mandelates, or camphorsulphonate) salts for example. The compounds of the present invention may also be resolved by the formation of diastereomeric amides by reaction of the compounds of the present invention with an optically active activated carboxylic acid such as that derived from (+) or (-) phenylalanine, (+) or (-) phenylglycine, (+) or (-)

153

Claims:

1. A compound having the formula,



or any mixture thereof, or a pharmaceutically acceptable salt thereof;

wherein

R is hydrogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl, cycloalkylalkyl or 2-hydroxyethyl;

R³ is -CH₂-X-R', wherein X is O, S, or NR'', wherein R'' is hydrogen, or alkyl, and R' is alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl, cycloalkylalkyl, or -CO-alkyl; and

R⁴ is

phenyl which may be substituted one or more times with substituents selected from the group consisting of halogen, CF₃, CN, alkoxy, cycloalkoxy, alkyl, cycloalkyl, alkenyl, alkynyl, amino, nitro, heteroaryl and aryl;

3,4-methylenedioxyphenyl;

benzyl which may be substituted one or more times with substituents selected from the group consisting of halogen, CF₃, CN, alkoxy, cycloalkoxy, alkyl, cycloalkyl, alkenyl, alkynyl, amino, nitro, heteroaryl and aryl;

heteroaryl which may be substituted one or more times with substituents selected from the group consisting of halogen, CF₃, CN, alkoxy, cycloalkoxy, alkyl, cycloalkyl, alkenyl, alkynyl, amino, nitro, heteroaryl and aryl; or

naphthyl which may be substituted one or more times with substituents selected from the group consisting of halogen, CF₃, CN, alkoxy, cycloalkoxy, alkyl, cycloalkyl, alkenyl, alkynyl, amino, nitro, heteroaryl and aryl.

154
154

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

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
CARLOS HUMBERTO PALACIO EASTMAN
Apoderado

ASUNTO	Radicación	06-001282
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio	<u>21 38 14</u>
	Folios	07

Patente de Invención ☒ Patente de Modelo de Utilidad ☐

Vía Nacional ☐

Vía PCT (fase nacional) ☒ Cap. I ☐ Cap. II ☒

No. Sol. Internacional PCT/EP2004/051651
Fecha de Presentación Internal. 29 de Julio de 2004

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:

1. Documentos estudiados

Descripción: Folios: 25 a 42 y 47 como se radicó inicialmente

Reivindicaciones: Folios 43 a 46 como se radicó inicialmente
Folios 53 a 56 modificadas
Folios 147 a 148 modificadas

Prioridad: Folios: 01
31 de Julio de 2003, DK, PA 2003 01117

Respuesta del solicitante: Folios 144 a 146

2. Análisis de la Prioridad

La fecha de prioridad del 31 de Julio de 2003 y su correspondiente documento, son aceptados para el estudio de patentabilidad.

3. Objeto de la invención

Titulo de la invención: Sales de 2-metoximetil-3-(3,4-diclorofenil)-8-azabicyclo [3.2.1]octan tartrato

Problema Técnico Planteado: obtener una sal fisiológicamente aceptable de del compuesto (1R, 2R, 3S, 5S)-2-metoximetil-3-(3,4-diclorofenil)-8-azabicyclo [3.2.1]octano con una óptima combinación de estabilidad, solubilidad, no-higroscopicidad, biodisponibilidad y buenas propiedades de manejo

Solución: sales de tartrato del compuesto (1R, 2R, 3S, 5S)-2-metoximetil-3-(3,4-diclorofenil)-8-azabicyclo [3.2.1]octano tales como L-tartrato monohidratadas y anhidras.

IPC: A61K 31/46, C07D 451/02

4. De la solicitud de Patente

Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

La reivindicación 2 se refiere a al compuesto en su forma *anhídrida*, se sugiere al solicitante expresar en forma anhidra.

Las reivindicaciones 5-7 se refieren a tres formas polimórficas diferentes del compuesto de la reivindicación 4, lo cual corresponde al compuesto 4 con tres características técnicas distintas. Se sugiere restringir a la(s) forma(s) polimórfica(s) que evidencien el aporte al estado de la técnica.

5. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha que se ha tenido en cuenta para determinar el Estado de la Técnica es:

- Fecha de presentación de la solicitud prioritaria: 31 de Julio de 2003

Considerando que la fecha de presentación de la primera solicitud de patente de la cual se reivindica prioridad es: 31/07/2003 se encontraron los siguientes documentos del estado de la técnica relacionados, que pueden afectar la patentabilidad del objeto de la presente solicitud:

Nº	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	WO 97/30997	Tropane-derivatives, their preparation and use	28/08/1997

6. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

Nivel inventivo (artículo 18 D486)

La reivindicación 1 consiste en:

Una sal seleccionada de las formas anhidra e hidratada de tartrato de (1R, 2R, 3S, 5S)-2-metoximetil-3-(3,4-diclorofenil)-8-azabicyclo [3.2.1] octano (en adelante compuesto I).

El Estado de la Técnica más cercano es **D1**, que enseña las sales del compuesto I (Ver página 34 y Folio 30-solicitud presentada); sugiriendo entre los ejemplos más representativos las sales tartrato (Ver página 7, líneas 1-7)

D1 además enseña que los compuestos de la invención pueden existir en las formas no solvatadas (anhidras), así como también en las formas solvatadas con solventes farmacéuticamente aceptables como agua (hidratadas). (Ver página 8, líneas 13-14)

En **D1** por ejemplo además se divulga que los compuestos pueden ser resueltos por cristalización fraccionada de d o l de las sales (tartratos) (Presencia de estereoisómeros) (Ver página 8, líneas 17-28)

Los compuestos objeto de esta solicitud se diferencian de los compuestos de **D1**, en que son explícitamente sus formas tartrato, anhidra o monohidrato, respectivamente.

El hecho de incluir estas diferentes formas polimórficas del compuesto, en los compuestos que se daban a conocer en D1, causa que se obtengan formas cristalinas alternas de las sales del compuesto I.

El Problema Técnico Objetivo era cómo modificar las sales del compuesto de D1, para obtener formas cristalinas alternas de las sales del compuesto I.

La reivindicación es obvia, porque el Experto en la Materia enfrentado al problema de "obtener formas cristalinas alternas" utilizaría el ión tartrato del compuesto I en sus formas anhidra e hidratada cómo se sugiere en D1, logrando de esta forma las formas alternas cristalinas del compuesto objeto de esta solicitud. Por lo tanto, la reivindicación 1 no tiene Nivel Inventivo. Las reivindicaciones dependientes 2 -8, no mencionan alguna característica que haga inventivos a los compuestos de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no tienen nivel inventivo.

7. Conclusión:

Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

N°	Documento N°	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO 97/30997	1-8	Nivel Inventivo

8. Respuesta a los argumentos del solicitante:

El solicitante en el Folio 145 refiere: "En relación a la novedad de la presente solicitud, es preciso indicar que los compuestos y sales reivindicadas en la presente invención son completamente nuevos a los revelados en el arte previo. Realizando una comparación exhaustiva de los dos documentos, es claro que ninguno de los compuestos revelados en D1 corresponde a la fórmula exacta de ninguno de los compuestos reivindicados en la presente invención. De acuerdo con lo anterior el diseño estructural de los compuestos es diferente a la de los expuestos en D1, por lo que consideramos que la presente solicitud es novedosa frente al arte previo conocido. Por esta razón, ponemos en consideración del Señor Examinador el retiro de sus objeciones a la novedad, haciendo énfasis en que está solo puede verse afectada en caso que la composiciones sea la misma"

De acuerdo con lo expuesto por el solicitante, en el Folio 25 de la solicitud presentada en antecedentes, se señala que el compuesto en mención y sus formas tartrato, anhidra e hidrato, se consideran novedosas teniendo en cuenta que no se encuentran de forma explícita en la solicitud.

Sin embargo, como en D1 ya se encontraban sugeridas sus sales tartrato, sus solvatos (con o sin agua) y la presencia de isómeros ópticos, un experto en la materia a partir de dichas enseñanzas derivaría de forma evidente y obvia las formas polimórficas de la solicitud presentada a partir de las sugerencias de D1, sin evidenciarse por lo tanto actividad inventiva.

El solicitante en el Folio 145, en el penúltimo párrafo se refiere a: "El lograr compuestos con propiedades mejoradas constituye un aporte importante al estado de la técnica, dada su aplicación industrial y comercial, por lo que la presente invención puede catalogarse como nueva e inventiva. Con el fin de dar una mayor soporte a los argumentos presentados, se anexa un estudio comparativo realizado para analizar las diferencias en propiedades como la higroscopicidad, entre las sales tartrato de la presente solicitud y la sal citrato ilustrada en el ejemplo 15 de D1. Es claro al observar este estudio que la sal tartrato reivindicada no es higroscópica en comparación con la sal citrato del arte previo.

Por esta razón, se puede inferir que los compuestos que hacen parte de la presente invención proporcionan la solución a un problema técnico real, y conceden un efecto técnico inesperado"

Los resultados anexados en las gráficas por el solicitante, ilustran que la sal L-tartrato monohidrato del compuesto I, no es higroscópica frente a la sal citrato, sin embargo dicho resultado, no se puede considerar inesperado teniendo en cuenta que el experto en la materia con el fin de realizar mejoras en las propiedades fisicoquímicas (solubilidad, punto de fusión, estabilidad, propiedades de flujo, higroscopicidad, entre otras) de las sales del compuesto I, utilizaría las sales tartrato, anhidra e hidrato ya sugeridas en D1, con métodos convencionales de cristalización para formación de polimorfos y obtener una sal no higroscópica, sin poseer actividad inventiva.

Para las demás formas polimórficas de la solicitud presentada, no se presentan mejoras en dichas propiedades fisicoquímicas que permitan evidenciar un efecto inesperado.

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 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 N° 10 de 2001.


ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Directora de Nuevas Creaciones (C)

122 OCT. 2018

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

CONCEPTO TÉCNICO No.01070

EXAMINADOR TÉCNICO
Código No. 202070