

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

2020
Bogotá, D.C.,

Abogada
ALICIA LLOREDA RICAURTE

ASUNTO	Radicación	08 116 342
	Trámite	011
	Evento	378
	Actuación	519
	Oficio	
	Folios	06

09163

Patente de Invención	☐	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Vía Nacional	☐	Cap. I	☐
Vía PCT (fase nacional)	☐	Cap. II	☐

No. Solicitud Internacional PCT/US2007/067367
Fecha de Presentación Internacional 25/Abril/2007

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 17 a 98	30/Octubre/2008
Reivindicaciones:	Folios 99 a 110	30/Octubre/2008
Oposiciones:	Folios 143 a 162	Lafrancol 24/Junio/2010
Prioridad:	US 60/797,659	05/Mayo/2006

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.

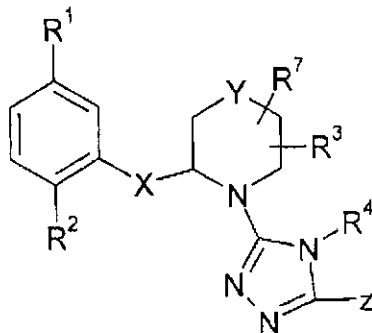
3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "Derivados de aminocicloalquil 1,2,4-Triazol como moduladores de MGLUR5" (modificado en el folio 114)

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar nuevos agonistas y antagonistas potentes del mGluR que exhiben una alta selectividad por los subtipos del mGluR, en particular el subtipo del receptor del grupo I, más particularmente el mGluR.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona compuestos de la fórmula (I), que exhiben una actividad en los receptores de

glutamato metabotrópicos (mGluR), especialmente el receptor mGluR5.



Compuestos de la fórmula (I)

El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D413/14, C07D401/14, C07D403/14, A61K31/513, A61K31/501, A61P25/02, A61P25/22, A61P1/04

4. Excepción a la Patentabilidad (Art 20 D486 literal d)

El objeto de las reivindicaciones 28 a 32 relacionado con un método de tratamiento no es patentable de acuerdo con el Art citado.

5. Reivindicaciones relativas a un uso (Art 14 D 486)

El uso de las reivindicaciones 21, 23 a 27 no es patentable, de acuerdo con el Art 14.

6. De la Solicitud de Patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

Las reivindicaciones 33 y 34 definen una combinación en términos de su función (inhibición de la secreción de ácido), por lo tanto se considera que tal reivindicación se refiere a todo agente que permita cumplir la función de inhibición de la secreción de ácido, por lo tanto se sugiere definir bajo la denominación común los compuestos que fueron objeto de comprobación para el caso de las combinaciones de los compuestos de fórmula (I) de la presente solicitud.

En la definición de los radicales más representativos de la fórmula (I), de acuerdo con lo que se encuentra debidamente sustentado en el capítulo descriptivo, se halla que siempre varían entre los siguientes grupos funcionales:

RADICAL	SOPORTE EN LA DESCRIPCION
R4	H, CH3
R5	H, CH3
R6	H, CH3

Por lo tanto se sugiere al solicitante presentar una generalización razonable y eliminar aquellas definiciones que exceden el sustento descriptivo.

7. Análisis de las Oposiciones

Oposición de Lafrancol

Afirma el opositor que esta solicitud incumple los requisitos de patentabilidad porque las composiciones farmacéuticas donde se involucra Omeprazol, Ranitidina, entre muchos otros son conocidas. El opositor argumenta que las moléculas se encuentran plenamente identificadas y con el fin de demostrar lo argumentado, anexa copias del libro "The Merck Index" (Fl. 151 a 154) para mostrar que los principios activos obtuvieron derechos patentarios.

Respuesta del Solicitante

El solicitante no se pronunció frente a la oposición de Lafrancol.

Respuesta del Examinador Técnico

Las copias del libro The Merck Index no desvirtúan la Novedad del objeto de esta solicitud, ya que estos no dan a conocer los derivados de aminocicloalquil 1,2,4-Triazol que actúan como moduladores de MGLUR5 o sus composiciones, por lo tanto no se considerarán dentro del Examen de Patentabilidad.

Los documentos EP0005129, US4255431 y US 5693818 divulgan la fórmula estructural de los compuestos piridilsulfonilbencimidazoles a los que pertenece el omeprazol y las preparaciones farmacéuticas.

Los documentos FR2384765 y US4128658 divulgan la fórmula estructural de los compuestos aminoalquilfuranos a los que pertenece la ranitidina y las preparaciones farmacéuticas.

Los documentos BE804144 y US3950333 divulgan inhibidores de receptores H-2 para el tratamiento de la secreción gástrica a los que pertenece la ranitidina y las preparaciones farmacéuticas.

Si bien las reivindicaciones 33 y 34 son combinaciones definidas en términos de la función, en ningún caso estas reivindicaciones reclaman los compuestos inhibidores de la secreción gástrica individualmente comprendidos, por el contrario estas combinaciones consisten en un compuesto de formula I y un agente inhibidor de la secreción gástrica. Por lo tanto estos documentos no se considerarán dentro del Examen de Patentabilidad.

8. Determinación del Estado de la Técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de prioridad (05/Mayo/2006) y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2005080386	Polyheterocyclic compounds and their use as metabotropic glutamate receptor antagonists	01/Septiembre/2005
D2	WO2004014902	New compounds	19/Febrero/2004

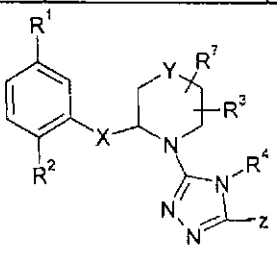
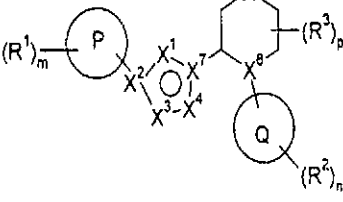
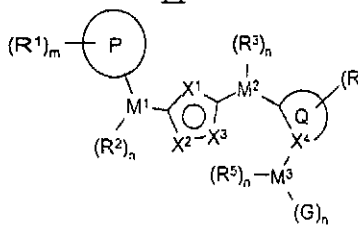
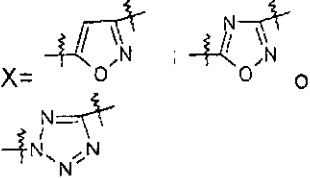
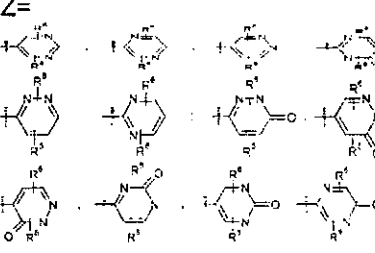
D1<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=2005080386&KC=&FT=E&locale=en> EP divulga agonistas de los receptores mGluRs (glutamato metabotrópico) útiles para enfermedades como el reflujo gastroesofágico (Pág. 4 y 86 a 88).
D2<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=2004014902&KC=&FT=E&locale=en> EP Divulga compuestos que tienen actividad sobre los receptores mGluRs) especialmente los receptores del grupo I, subtipo mGluR5 que median la excitación postsinaptica y pueden ser útiles en el tratamiento de enfermedades del SNC como el Alzheimer (Pág. 3 y 85 a 88).

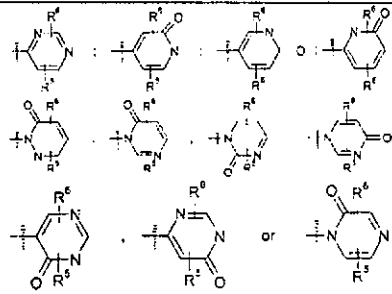
9. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en un compuesto de fórmula (I), donde: (Fl. 99 a 101, Pág. 83 a 85 líneas 1 – 10).

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

Características esenciales	D1	D2
Compuesto de fórmula (I) 	Compuesto de fórmula (I) 	Compuesto de fórmula (I) 
R1=metil, halógeno o CN	No menciona	G= anillo 5-6 de C,N,S sustituido por A
R2=H, F	R2= H,OH,halógeno	A=H,OH, halo
R3,R7=H, F, alquilo	R3= H,OH,alquilo	R4=H,OH,halo,alquil
R4= alquilo,ciclopropil	X1= N,CR y NR	X1= N,CR y NR
Y= CR,O,S,SO,NR	X5= CR, NR,O,S,SO	M2=enlace C-C, C-O, C-N,C-S Q= Anillo C4-7 con al menos un heteroatomo N,O,S X4= C,CR,N
X= 	Q= heteroarilo	M3=enlace C-C, C-O, C-N,C-S
Z= 	P= arilo y heteroarilo.	M1=enlace C-C, (CO)NR, CNRR P= anillo de 3 a 8 miembros que contiene uno o más átomos de C,N,O o S. R1= H,alquil,alcoxi,haloalcoxi,halo alquil, halógeno

 R5=H, alquil, alcoxi, haloalcoxi, haloalquil, halógeno R6=H, alquil, alcoxi, haloalcoxi, haloalquil, halógeno		
Sales, hidratos, isoformas, tautómeros y enantiómeros farmacéuticamente aceptables	Sales, hidratos y enantiómeros farmacéuticamente aceptables	Sales

Los documentos D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1. D1 divulga agonistas de los receptores mGluRs (glutamato metabotrópico) útiles para enfermedades como el reflujo gastroesofágico (Pág. 4). D2 divulga compuestos que tienen actividad sobre los receptores mGluRs) especialmente los receptores del grupo I, subtipo mGluR5 que median la excitación postsinaptica y pueden ser útiles en el tratamiento de enfermedades del SNC como el Alzheimer (Pág. 3).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y los compuestos de fórmula I de D1, corresponde al enlace C-N entre el carbono del triazol y el nitrógeno del heterociclo similar a la piperidina; adicionalmente el compuesto tiene un heterociclo de 5 miembros unido al aminocicloalquil y al fenilo sustituido.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y los compuestos de fórmula I de D2; consiste en la unión directa a través de un enlace C-N o C-C entre el carbono del triazol y el sustituyente heterociclo (Z).

El efecto logrado por el hecho de tener cambios en los enlaces de los compuestos y en los radicales de los compuestos de D1 y D2; es tener una alternativa adicional a los compuestos conocidos en el estado de la técnica que actúan sobre los receptores mGluRs (glutamato metabotrópico).

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo modificar los compuestos de fórmula I conocidos en D1 para conseguir compuestos alternativos que actúen sobre los receptores mGluRs (glutamato metabotrópico)".

Sin embargo, la posibilidad de unir los anillos heterociclicos con otros enlaces químicos ya está divulgada en el documento D2 que sugiere un enlace entre el carbono del triazol y el nitrógeno del heterociclo similar a la piperidina (Pág. 86) y en el documento D1 que sugiere la unión directa a través de un enlace C-N o C-C entre el carbono del triazol y el sustituyente heterociclo (Pág. 86). Adicionalmente no se observa en la información suministrada en la descripción que los compuestos de la presente solicitud, tengan una mejor actividad en los receptores mGluRs (glutamato metabotrópico) en comparación a los compuestos revelados en D1 y D2.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, cambiaría el enlace entre el triazol y el análogo de piperidina en los compuestos de fórmula I de D1 pero manteniendo el grupo farmacóforo; para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo que la materia reivindicada se deriva evidentemente a partir del estado de la técnica o es obvia a partir de las enseñanzas de los documentos.

Conclusión:

La reivindicación 1 cumple el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 a 20 y 33 a 35 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

10. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2005080386	1 a 20 y 33 a 35	Nivel Inventivo
D2	WO2004014902	1 a 20 y 33 a 35	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.

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
07 JUN. 2012

Elaborado por: Ruth Angélica Lizarazo Pedraza
Revisado por: Consuelo Leguizamón Leguizamón

