

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 43110

Por la cual se otorga parcialmente una patente de invención

CERTIFICADO

Rad. No. 09-80215

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 día 31 de julio de 2009 con el N° 09-080215-00000-0000, la(s) sociedad(es) Les Laboratoires Servier, presentó la solicitud de patente de invención titulada "NUEVO PROCEDIMIENTO DE SÍNTESIS DE LA AGOMELATINA".

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 612 del 29 de enero de 2010, habiéndose presentado oposición por parte de la(s) sociedad(es) Gynopharm S.A., la(cual(es) una vez fue(ron) estudiada(s) por el Despacho, no desvirtuó la patentabilidad del objeto en estudio como se analizará mas adelante.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 1100, notificado por fijación en lista el 29 de enero 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 la solicitante mediante escrito radicado bajo el N° 09-080215-00009-0000 del 18 de abril de 2013, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó nueva(s) reivindicación(es) 1 a 10 que remplace(n) las originalmente presentadas, atendiendo de esta manera las observaciones efectuadas en el examen de fondo. Se aceptó el nuevo capítulo reivindicatorio presentado, comoquiera que se ajusta a las prescripciones contenidas en el artículo 34 de la Decisión 486.

Análisis de la oposición presentada por la sociedad Gynopharm S.A.

El opositor señala que la solicitud y lo reivindicado no es objeto de patentabilidad porque no cumple con uno de los tres requisitos de patentabilidad:

1. Carece de altura inventiva: en el documento D1 (EP0447285, publicado el 18 de septiembre de 1991) se define la preparación de N-[2-(7-metoxi-1-naftil)etil]acetamida; el documento D2 (EP1564202, publicado el 17 de agosto de 2005) divulga métodos de síntesis del mismo compuesto, en donde, "según el ejemplo 1, se hace reaccionar con paladio, 7-metoxi-3,4-

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 43110

Por la cual se otorga parcialmente una patente de invención

CERTIFICADO

Rad. No. 09-80215

dihidro-1-naftalenil)acetonitrilo en solución en tolueno para formar (7-metoxi-1-naftil)acetonitrilo". De lo anterior concluye "[...] cualquier persona versada en la materia puede llegar de manera evidente, a partir de la combinación de los documentos D1 y D2, por técnicas conocidas por una persona versada que llevaría a cabo, reaccionar el 7-metoxi-1-naftol de fórmula II, sobre el que se condensa, en presencia de paladio, después que la función hidroxí se transforma en un grupo saliente como el grupo halógeno, tosilato o trifluorometanosulfonato, el compuesto de fórmula III, por lo que no implica actividad inventiva".

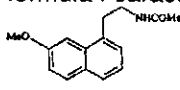
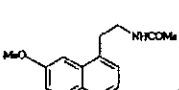
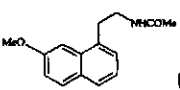
Respuesta de la solicitante

Afirma el solicitante que "no puede considerarse que la técnica anterior citada destruya el paso novedoso o inventivo de la presente invención", soportado en los siguientes argumentos: "[...] D1 y D2 describen el acceso a la agomelatina a partir de 7-metoxi-1- tetralona en 8 y en 4 pasos, respectivamente. Ese material de base adolece de dos inconvenientes: resulta costoso y difícil de obtener con buena calidad". Argumenta que el 7-metoxi-1-naftol es un material de base muy económico y muy fácil de obtener. Agrega "[...] este método alternativo de síntesis evita la inclusión de un paso de aromatización en dicha síntesis, paso que siempre resulta problemático desde el punto de vista industrial, puesto que 7-metoxi-1-naftol ya posee un sistema de anillo de naftaleno en su estructura". Además, "el uso de 7-metoxi-1-naftol como material de base para una reacción Heck a efectos de obtener agomelatina no se sugiere en D1 ni en D2".

Respuesta del Examinador Técnico

El opositor falló en demostrar por qué el objeto de la solicitud carece de nivel inventivo como lo insinuó inicialmente. El juicio comparativo de los documentos citados por el opositor con la invención no permite concluir la carencia de nivel inventivo de la invención.

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

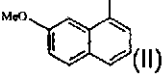
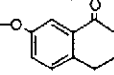
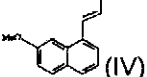
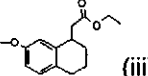
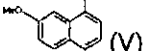
Características esenciales	D1	D2
Síntesis industrial del compuesto de fórmula I caracterizado porque:  (I)	Síntesis del compuesto de fórmula I caracterizado porque:  (I)	Síntesis del compuesto de fórmula I caracterizado porque:  (I)
Transforma la función hidroxí se	Hacer reaccionar 7-metoxi-1-	Hacer reaccionar 7-metoxi-1-

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 43110
Por la cual se otorga parcialmente una patente de invención

CERTIFICADO

Rad. No. 09-80215

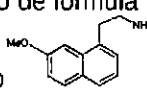
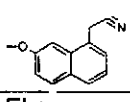
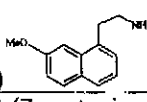
Características esenciales	D1	D2
transforma en grupo saliente como el grupo halógeno, tosilato o trifluorometanosulfonato del 7-metoxi-1-naftol de fórmula II 	tetralona (ii) con bromo-acetato de etilo en benceno. Agregar zinc y cristales de yodo. Hidrogenación en presencia de HCl, extraer con benceno, secar y llevar a ebullición en presencia de P₂O₅. Para obtener Acetato de 7-metoxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftilideno (fl 111, etapa A, lns 34-42). 	tetralona, con ácido ciano-acético para obtener en tolueno en presencia de bencilamina para obtener (7-metoxi-3,4-dihidro-1-naftenil)acetonitrilo (fl 153, ejemplo 1, lns 14-23)
El compuesto obtenido se pone a reaccionar, en presencia de paladio, con el compuesto de fórmula III (CH₂=CH-R) para dar lugar al compuesto de fórmula IV 	Hacer reaccionar 7-metoxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftilideno (iii) con azufre a 215°C por 10 horas. Enfriar y agregar acetato de etilo agitando por 30 minutos, para obtener etil acetato de 7-metoxi-naft-1-ilo (fl 111, etapa B, lns 44-50). 	Hacer reaccionar (7-metoxi-3,4-dihidro-1-naftenil)acetonitrilo con paladio sobre carbono y tolueno para obtener (7-metoxi-1-naftenil)acetonitrilo (fl 153, ejemplo 1, lns 25-33)
El compuesto de fórmula IV se somete a hidrogenación catalítica para dar lugar al compuesto de fórmula V 	Hacer reaccionar etil acetato de 7-metoxi-naft-1-ilo (iv) en solución etanólica de NaOH al 20% en reflujo por 3 horas, secar, lavar en éter y precipitado con una corriente de HCl gas, para obtener ácido (7-metoxi-naft-1-il) acético (fl 111, etapa C, lns 52-58).	
	Solubilizar ácido (7-metoxi-naft-1-il) acético (v) en cloroformo y hacer reaccionar con cloruro de tionilo en reflujo por 2 horas para obtener cloruro de (7-metoxi-naft-1-il)acetilo (fl 112, etapa D, lns 1-6).	
	Disolver cloruro de (7-metoxi-naft-1-il)acetilo (vi) en éter anhídrido. Hacer reaccionar con amoníaco, para obtener (7-metoxi-naft-1-il)acetamida (fl 112, etapa E, lns 8-16)	
	Disolver (7-metoxi-naft-1-il)acetamida (vii) en THF anhidro y hacer reaccionar con trietilamina. Agregar ácido trifluoroacético. Se obtiene (7-metoxi-naft-1-	

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 43110
Por la cual se otorga parcialmente una patente de invención

CERTIFICADO

Rad. No. 09-80215

Características esenciales	D1	D2
	il)acetonitrilo (fl 112, etapa F, Ins 18 -28)	
El compuesto de fórmula V se somete a una hidrólisis básica o ácida, o a un sistema binario reductor/ácido para dar lugar al compuesto de fórmula VI o a su  (VI) clorhidrato	Hidrogenar (7-metoxi-naft-1-il)acetonitrilo (viii) en presencia de níquel (fl 112, etapa G, Ins 30-35, para obtener 2-(7-metoxi-naftil-1-il)etilamina.  (viii)  (ix)	Hidrogenar (7-metoxi-naft-1-il)acetonitrilo en presencia de níquel (fl 153, ejemplo 1, Ins 36-43), para obtener 2-(7-metoxi-naftil-1-il)etilamina.
El compuesto de fórmula VI se somete sucesivamente a la acción de acetato de sodio y anhídrido acético para dar lugar al compuesto de fórmula I que se aísla en forma de un sólido.	El compuesto 2-(7-metoxi-naftil-1-il)etilamina (ix) se refrigera en baño de hielo y se agrega cloruro de acetilo, agitando por 30 minutos, para dar lugar al compuesto de fórmula I que se aísla en forma de un sólido (fl 113, ejemplo 1, Ins 6 – 19).	El compuesto de fórmula VI se somete sucesivamente a la acción de acetato de sodio y anhídrido acético para dar lugar al compuesto de fórmula I que se aísla en forma de un sólido.

Según el opositor, los documentos D1 y D2 (denominación tomada de lo argumentado por el opositor) se consideran el estado de la técnica cercano porque divulgan proceso de síntesis del compuesto N-[2-(7-metoxi-1-naftil)etil]acetamida.

El proceso reivindicado difiere de los de D1 y D2 en que parte de 7-metoxi-1-naftol.

El efecto logrado por el hecho de partir de este compuesto es que parte de un compuesto accesible y no incluye pasos de aromatización.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo a resolver consiste en la necesidad de suministrar un procedimiento alternativo para la síntesis de agomelatina a partir de materias primas accesibles evitando pasos de aromatización.

No existe indicación en el estado de la técnica de que el compuesto 7-metoxi-1-naftol sea materia prima para la síntesis del compuesto en comento.

De manera que el estado de la técnica no sugiere a la persona del oficio normalmente versada en la materia la forma en que se resuelve el problema de esta solicitud. Por lo cual no se considera obvia.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 43110

Por la cual se otorga parcialmente una patente de invención

CERTIFICADO

Rad. No. 09-80215

De acuerdo con lo expuesto, considera esta Superintendencia que los argumentos presentados por la sociedad opositora no están debidamente sustentados, por lo mismo, no prosperan frente a la solicitud que aquí se analiza, como elementos que permitan desvirtuar su patentabilidad.

QUINTO: 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."*

5.1. Objeto de la invención.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar un procedimiento para la síntesis de agomelatina (N-[2-(7-metoxi-1-naftil)etil]acetamida) a partir de materias primas accesibles.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un procedimiento de síntesis industrial del compuesto de fórmula (I) caracterizado porque se pone a reaccionar el 7-metoxi-1-naftol de fórmula (II) sobre el que se condensa, en presencia de paladio, después que cuya función hidroxil se transforma en grupo saliente como el grupo halógeno, tosilato o trifluorometanosulfonato, el compuesto de fórmula (III), para dar lugar al compuesto de fórmula (IV), que se somete a hidrogenación catalítica para dar lugar al compuesto de fórmula (V), que se somete a una hidrólisis básica o ácida, o a un sistema binario reductor/ácido para dar lugar al compuesto de fórmula (VI) o a su clorhidrato, que se somete sucesivamente a la acción de acetato de sodio y anhídrido acético para dar lugar al compuesto de fórmula (I) que se aísla en forma de un sólido.

5.2 Determinación del estado de la técnica.

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 05 de agosto de 2008, 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 encontró (encontraron) el (los) siguiente(s) documento(s) que anticipa(n) el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de publicación
D3	EP 0279466	"Novel naphthalene derivatives and antiallergy and anti-inflammatory pharmaceuticals"	24/Agosto/1988

Página 5 de 8

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 43110
Por la cual se otorga parcialmente una patente de invención

CERTIFICADO

Rad. No. 09-80215

El documento D3 ¹ divulga (pág. 8, ejemplo 3) el compuesto 7-metoxi-1-naftenol como intermediario en la síntesis de derivados de naftaleno antialérgicos y antiinflamatorios.

5.3. Novedad.

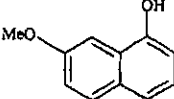
Según lo dispuesto en el artículo 16 de la Decisión 486: *“Una invención se considerará nueva cuando no está comprendida en el estado de la técnica.*

El estado de la técnica comprenderá todo lo que haya sido accesible al público por una descripción escrita u oral, utilización, comercialización o cualquier otro medio antes de la fecha de presentación de la solicitud de patente o, en su caso, de la prioridad reconocida”.

En el presente caso, el compuesto reclamado en la solicitud no es nuevo, teniendo en cuenta que la reivindicación 7 está referida a: *“Compuesto de fórmula (II) de acuerdo con la reivindicación 1 como intermediario en la síntesis de agomelatina” (Ver página 6 del radicado N° 09-080215-00009-0000)*

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) D3 que representa(n) el estado de la técnica:

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

Características esenciales	D3
Compuesto de fórmula (II) 	7-metoxi-1-naftenol (pág. 8, ejemplo 3)

Las características esenciales del compuesto de la reivindicación 7 habían sido divulgadas previamente en D3, el cual da a conocer el compuesto 7-metoxi-1-naftenol (pág. 8, ejemplo 3).

En consecuencia, la reivindicación 7 no es nueva según lo divulgado en el documento D3

SEXTO: Que de acuerdo con lo expuesto, en el presente caso la(s) reivindicación(es) 1 a 6 y 8

1URL: D3http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=EP&NR=0279466B1&KC=B1&FT=D&ND=&date=19930519&DB=&&locale=en_EP

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 43110

Por la cual se otorga parcialmente una patente de invención

CERTIFICADO

Rad. No. 09-80215

a 10, cumplen los requisitos de novedad, nivel inventivo y aplicación industrial de que trata el artículo 14 de la Decisión 486, por lo tanto hay lugar a conceder para ellas el privilegio de patente solicitado; así mismo, se niega el privilegio de patente para la(s) reivindicación(es) 7, por carecer de novedad como se explicó anteriormente.

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Declarar infundada la oposición presentada por la(s) sociedad(es) Gynopharm S.A., de acuerdo con las razones expuestas en la parte considerativa de la presente Resolución.

ARTÍCULO SEGUNDO: Otorgar patente de invención para la creación titulada:

" NUEVO PROCEDIMIENTO DE SÍNTESIS DE LA AGOMELATINA "

Clasificación IPC: A61K 31/165; C07C 231/06 // C07C 231/02.

Reivindicación(es): 1 a 6 y 8 a 10 incluida(s) en el radicado bajo el N° 09-080215-00009-0000.

Titular(es): LES LABORATOIRES SERVIER.

Domicilio(s): Cedex, Francia.

Inventor(es): Christophe Hardouin, Jean-Pierre Lecouve y Nicolas Bragnier.

Prioridad(es) N°: 08/04465 75 INPI- Paris SP34. **Fecha:** 05 de agosto de 2008. **País:** FR.

Vigente desde: 31 de julio de 2009. **Hasta:** 31 de julio de 2029.

ARTÍCULO TERCERO: Denegar la patente de invención solicitada para la reivindicación 7, de acuerdo con las razones expuestas en la parte considerativa de la presente resolución.

ARTÍCULO CUARTO: El titular tendrá los derechos y las obligaciones establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina y en las demás disposiciones legales vigentes sobre propiedad industrial, precisando que para mantener vigente la patente se deberá cancelar la tasa anual de mantenimiento, conforme lo dispone el artículo 80 de la referida norma comunitaria.

ARTÍCULO QUINTO: Entregar al titular copia auténtica de esta resolución y el certificado de

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 43110

Por la cual se otorga parcialmente una patente de invención

CERTIFICADO

Rad. No. 09-80215

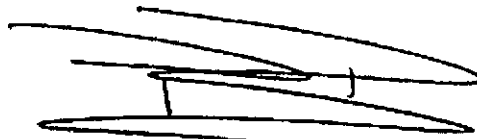
patente, previas las anotaciones en los libros de registro.

ARTÍCULO SEXTO: Notificar el contenido de la presente resolución a la(s) sociedad(es) Les Laboratoires Servier, y a la(s) sociedad(es) opositora(s) Gynopharm S.A., entregándoles copia de la misma y advirtiéndoles que contra ellas 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 25 Jul 2013

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor(a)

NATALIA CABRERA MARTÍNEZ

nataliacabera@estrategiajuridica.net

Doctor(a)

CIELO ÁNGELA PEÑA RODRÍGUEZ

negocios@optimum-co.com

Elaboró: Nelson Ricardo Velasco Gonzalez ✓

Revisó: Lyna Del Carmen Mordecay Dunoyer ✓

Revisó: Maria Del Socorro Pimienta Corbacho ✓

Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez ✓