

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO			
RAD: 14-22058- -3	FECHA: 2015-02-17 09:27:43		
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I		
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 8		
ACT: 519 PRESENTACION			

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
CARLOS R. OLARTE GARCIA

Asunto: Radicación: 14-22058- -3
Trámite: 11
Evento: 378
Actuación: 519
Oficio: 1737
Folios: 8

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/EP2012/065140				
Fecha de Presentación Internacional	02/08/2012				

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:	Radicado 14-022058-00000-0000	03/Febrero/2014
Reivindicaciones:	Radicado 14-022058-00000-0000	03/Febrero/2014
	Radicado 14-022058-00002-0000	26/Noviembre/2014
Prioridad:	EP 11176468.4	03/Agosto/2011

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.

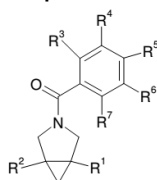
3. Objeto de la invención

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. Con relación a la presente solicitud se realizó el pago de las reivindicaciones adicionales y se estudiarán las reivindicaciones 1 a 13 de acuerdo con el radicado 14-022058-00002-0000.

Título de la solicitud: “Fenil-3-Aza-biciclo[3,1,0]hex-3-il-metanonas y su uso como medicamento”

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar compuestos útiles en el tratamiento de trastornos neurológicos y psiquiátricos.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de fórmula (I)



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 401/04, 403/04, 413/04, 413/14, 417/04, 471/04; A61K 31/421, 31/427, 31/437, 31/4439; A61P 25/18, 25/28.

4. De la solicitud de patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

Las reivindicaciones 1-6 y 13 no son claras porque el término “opcionalmente” es impreciso, por lo cual, no permite distinguir la invención del estado de la técnica. Se sugiere sustituirlo por un término concreto.

La reivindicación 12 no es clara porque las composiciones se deben definir en términos de sus ingredientes y proporciones, denominando a los ingredientes activos por su nombre IUPAC o por su denominación común internacional y en cuanto a los excipientes de formulación en términos de su nombre común, se sugiere hacer las aclaraciones pertinentes.

Las reivindicaciones 1-6 y 13 no son concisas porque las definiciones de R1, R2, R3, R4, R5, R6 y R7 son generales, se sugiere restringir la solicitud a los sustituyentes que habían sido probados, es decir, que se encuentren debidamente sustentados a través de ejemplos concretos de acuerdo con lo presentado en la tabla No 1.

Sustituyente R1 y R2	Ejemplos concretos
R3, R4, R5, R6, R7	
Sales	No sustenta
Solvato	No sustenta

Se requiere al solicitante hacer las aclaraciones necesarias.

La solicitud no cumple con el requisito de unidad de invención porque se refiere a 2 grupos inventivos.

1. Cuando R3 y R4 no están fusionados al fenilo adyacente.
2. Cuando R3 y R4 están fusionados al fenilo adyacente.

EL documento US7557114 divulga las modalidades arriba expuestas comoquiera que revela compuestos derivados de fenil metanonas como inhibidores GlyT-1 útiles en el tratamiento de enfermedades del sistema nervioso como la psicosis, la demencia, disfunciones de memoria, desordenes de déficit de atención y Alzheimer (Resumen).

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de la cual se invoca prioridad, es decir, agosto 03 de 2011. 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	US7557114	"Heterocyclic-substituted phenyl methanones"	07/Julio/2009
D2	WO2008081399	"2-Aza-bicyclo[3.1.0]hexane derivatives"	10/Julio/2008
D3	WO2004089363	"Substituted azabicyclo hexane derivatives as muscarinic receptor antagonists"	21/Octubre/2004

El documento D1⁽¹⁾ divulga compuestos derivados de fenil metanonas como inhibidores GlyT-1 útiles en el tratamiento de enfermedades del sistema nervioso como la psicosis, la demencia, disfunciones de memoria, desordenes de déficit de atención y Alzheimer (Resumen).

El Documento D2⁽²⁾ divulga compuestos derivados de 2-aza-biciclo[3.1.0]hexano como agonistas de los receptores orexin, útiles en el tratamiento de la neurosis, desordenes maniáticos depresivos, delirio, psicosis, esquizofrenia, paranoia, desordenes de personalidad, fobias, desordenes compulsivos/obsesivos y ansiedad (Resumen y Pág. 165, Rv. 11).

El documento D3⁽³⁾ divulga compuestos derivados de azabicyclo hexano como inhibidores de los receptores muscarínicos (Resumen).

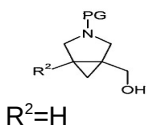
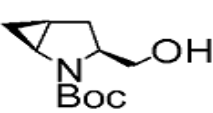
7. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

La reivindicación 13 consiste en *"Un compuesto seleccionado de uno de cualquiera de las fórmulas generales (II),(III),(IV), (V), o, (VI)"*.

-Modalidad: Compuesto (III)

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

Características esenciales	D2
Formula General (III)  R²=H	Compuesto 5  (Pág. 35)

De acuerdo con la tabla anterior, las características esenciales del compuesto (III) de la reivindicación 13 habían sido divulgadas previamente en el documento D2, por lo tanto, la materia reivindicada no es nueva.

1. [www.google/patents/ US7557114](http://www.google/patents/US7557114)

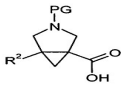
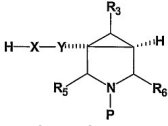
2. [www.google/patents/ WO2008081399](http://www.google/patents/WO2008081399)

3. [www.google/patents/ WO2004089363](http://www.google/patents/WO2004089363)

En consecuencia, la reivindicación 13 carece de novedad, según lo divulgado en el documento D2.

-Modalidad:Fórmula general (V)

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

Características esenciales	D3
Fórmula General (V)  R2=H	 Y=-(CH₂)_{q=0} X=Ausente R5=H R6=H R3=COOH (Pág. 7, esquema 7 y Pág. 20, Rv. 1)

De acuerdo con la tabla anterior, las características esenciales del compuesto (V) de la reivindicación 13 habían sido divulgadas previamente en el documento D3, por lo tanto, la materia reivindicada no es nueva.

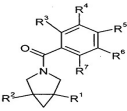
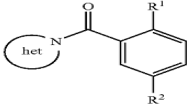
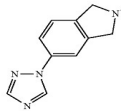
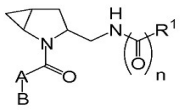
En consecuencia, la reivindicación 13 carece de novedad, según lo divulgado en el documento D3.

Nivel inventivo (Art18 D486)

El grupo inventivo estudiado en el presente examen de patentabilidad corresponde al No 1.

La reivindicación 1 consiste en “*Un compuesto de la fórmula general (I) o una de sus sales en donde R1 está seleccionado del grupo de a) heteroarilo monociclo de 5 ó 6 miembros, (...)*”.

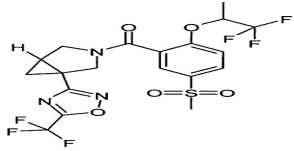
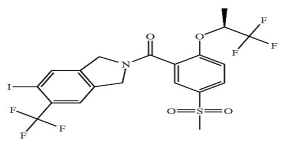
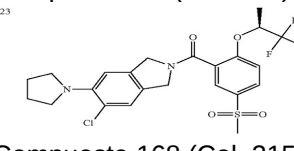
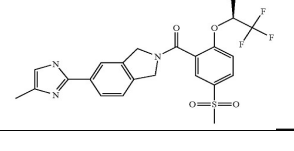
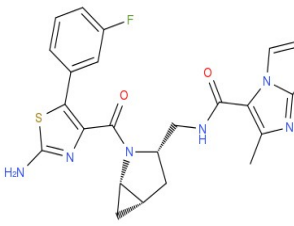
Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D1	D2
Compuesto de fórmula general (I)  R1 =Heteroarilo monociclo de 5 miembros que tiene de 1 a 4 heteroátomos de Nitrógeno R2=Hidrógeno	Compuesto de fórmula I    (Col. 309, Ej. 348 y Cols. 327-328)	Compuesto de fórmula(I)  Formula (I) n=0 R1=Arilo (Pág. 149, Rv. 1)
R3=Alquilo C₁-C₆-O- R4=Hidrógeno	R1=-OR¹ R¹=Bajo alquilo	A=Arilo sustituido (C₁₋₄)alcoxi

R5=Hidrógeno R6=Hidrógeno R7=-S(O) _u -alquilo u=2	R2=-S(O) ₂ -bajo alquilo (Cols. 327-328)	B=Ariilo
---	--	----------

Los documentos D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque en el caso del documento D1 compuestos derivados de fenil metanonas como inhibidores GlyT-1 útiles en el tratamiento de enfermedades del sistema nervioso como la psicosis, la demencia, disfunciones de memoria, desordenes de déficit de atención y Alzheimer (Resumen). Por su parte, el documento D2 divulga compuestos derivados de 2-aza-biciclo[3.1.0]hexano como agonistas de los receptores orexin, útiles en el tratamiento de la neurosis, desordenes maniáticos depresivos, delirio, psicosis, esquizofrenia, paranoia, desordenes de personalidad, fobias, desordenes compulsivos/obsesivos y ansiedad (Resumen y Pág. 165, Rv. 11).

Los compuestos reclamados presentan similitudes estructurales con los compuestos divulgados en el documento D1 y D2 de acuerdo a lo presentado en el siguiente cuadro:

Solicitud	D1	D2
Rv. 7. 	Compuesto (d) (Col.138)  Compuesto 23 (Col. 149)  Compuesto 168 (Col. 215) 	Ácido 6-metil-imidazo[2,1-b]tiazol-5-carboxílico {(1S,3S,5S)-2-[2-amino-5-(3-fluoro-fenil)-tiazol-4-carbonil]-2-aza-biciclo[3.1.0]hex-3-ilmetil}-amida  (Pág. 151, Rv. 9).

La diferencia entre los compuestos, definidos en la reivindicación 1 y los compuestos revelados en el documento D1 consiste en que los compuestos reclamados incluyen en su estructura un anillo biciclo nitrogenado 3-aza-biciclo[3,1,0]hexano mientras que los compuestos divulgados en el documento D1 incluyen en su estructura un anillo biciclo nitrogenado tipo indol.

No se evidencia un efecto técnico sorprendente o inesperado atribuible a la diferencia expuesta comoquiera que los compuestos reclamados presentan una actividad inhibitoria GlyT1 comprendida entre 5nM-3000nM (Págs. 61-63), mientras que los compuestos revelados en el documento D1 enseñan una actividad inhibitoria GlyT1 comprendida entre 2nM-42nM (Cols. 34-35).

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo proporcionar compuestos alternativos a partir de los compuestos divulgados en el documento D1 útiles en el tratamiento de

enfermedades del sistema nervioso central y psiquiátricas”.

Sin embargo, la inclusión de un anillo biciclo nitrogenado 3-aza-biciclo[3,1,0]hexano en estructuras de compuestos útiles en el tratamiento de enfermedades del sistema nervioso central y psiquiátrica, está divulgada en el documento D2 que enseña compuestos derivados de 2-aza-biciclo[3.1.0]hexano como agonistas de los receptores orexin, útiles en el tratamiento de la neurosis, desordenes maniáticos depresivos, delirio, psicosis, esquizofrenia, paranoia, desordenes de personalidad, fobias, desordenes compulsivos/obsesivos y ansiedad (Resumen y Pág. 165, Rv. 11).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría un anillo 2-aza-biciclo[3.1.0]hexano en las estructuras de los compuestos revelados en el documento D1 de acuerdo con lo divulgado en el documento D2, para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2-12 no mencionan características técnicas esenciales acerca del compuesto reclamado, tampoco se pueden considerar inventivas.

8. Conclusión

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

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	US7557114	1-12	Nivel inventivo
D2	WO2008081399	13 1-12	Novedad Nivel inventivo
D3	WO2004089363	13	Novedad

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 del día siguiente 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 2015-02-24

Elaboró: German Antonio Clavijo Cohen

Revisó: Consuelo Leguizamon Leguizamon