

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 11443 de 22 de julio de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0008012

Señores
TAKEDA PHARMACEUTICAL COMPANY LIMITED

TÍTULO DE LA SOLICITUD: “ANTAGONISTAS HETEROCÍCLICOS DE NMDA”
NUMERO DE SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/IB2020/000962
FECHA DE PRESENTACIÓN INTERNACIONAL: 12 de noviembre de 2020.
PRIORIDAD: JP 2019-206311 14 de noviembre de 2019.

Como resultado del examen de patentabilidad realizado a la solicitud indicada en la referencia, atendiendo a lo consagrado en el artículo 45 de la Decisión 486 de 2000, se le comunica que esta Dirección ha encontrado que la materia objeto de solicitud no cumple con algunos requisitos establecidos en la Decisión, con fundamento en los siguientes aspectos:

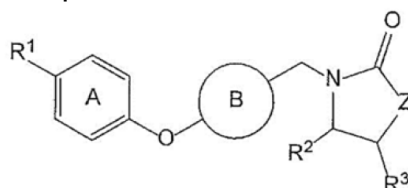
1. Modificaciones presentadas

Revisada la modificación a la solicitud objeto de estudio, la cual fue radicada el 30 de noviembre de 2022 bajo el número NC2022/0017256, y teniendo en cuenta lo señalado en el artículo 34 de la Decisión 486 de 2000 de la Comisión de la Comunidad Andina, esta oficina acepta las modificaciones presentadas por ajustarse a los requisitos legales.

2. Objeto de la invención

El problema planteado consiste en la necesidad de obtener compuestos que actúen sobre el receptor NMDA, más específicamente sobre la subunidad NR2B es ampliamente funcional en el cerebro y puede ser eficaz en la profilaxis o el tratamiento de enfermedades del sistema nervioso central.

Para resolver dicho problema técnico, la solicitud en estudio proporciona compuestos heterocíclicos y composiciones farmacéuticas que comprenden los mismos, que pueden tener una acción antagonista sobre un receptor NMDA que contiene una subunidad NR2B y pueden ser útiles como agentes profilácticos o terapéuticos para depresión, trastorno bipolar, migraña, dolor, síntomas periféricos de demencia o similares.



3. Reivindicaciones estudiadas

El presente estudio se basa en el capítulo reivindicatorio presentado el 30 de noviembre de 2022 bajo el número NC2022/0017256.

Oficio N° 11443 de 22 de julio de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0008012

4. De la solicitud de patente

4.1. Título

De conformidad con el literal d) del artículo 27 de la Decisión 486 de 2000 de la Comisión de la Comunidad Andina, el nombre de la invención de que se trata deberá reflejar el objeto y el campo industrial con el cual se relaciona la misma y ser concordante con la materia descrita y las reivindicaciones de la solicitud. El nombre no podrá referirse a nombres personales, marcas de productos o nombres de fantasía.

El título de la solicitud no refleja el objeto divulgado en la descripción y las reivindicaciones, por lo cual se sugiere el siguiente título: "COMPUESTOS DERIVADOS DE OXAZOLIN – 2 – ONA COMO ANTAGONISTAS DE NMDA".

4.2. Reivindicaciones

Teniendo en cuenta lo establecido en el artículo 30 de la Decisión 486 de 2000 de la Comisión de la Comunidad Andina:

"Las reivindicaciones definirán la materia que se desea proteger mediante la patente. Deben ser claras y concisas y estar enteramente sustentadas por la descripción. (...)"

Esta Oficina informa que las reivindicaciones 1 a 5 no son claras, porque la referencia a "opcionalmente sustituido" genera que la característica reclamada no sea esencial, sino que sea optativa. Por lo tanto, se sugiere eliminar esta referencia y definir cuales sustituciones son esenciales y cuáles no.

Esta Oficina informa que la reivindicación 1 no es clara, porque la expresión "al menos" es imprecisa, dado que no permite diferenciar la invención con respecto al estado de la técnica. Por lo tanto, se sugiere eliminar esta referencia y definir el numero o rango correspondiente para los números de flúor.

Esta Oficina informa que las reivindicaciones 6 y 7 no son claras, porque la caracterización de las respectivas formas cristalinas está incompleta. Cuando la determinación del patrón de difracción de rayos X se realiza en monocristal, la caracterización se considera completa y suficiente. Para el caso de que la determinación del patrón de difracción de rayos X se realice en polvo, se deberá incluir una segunda técnica cristalográfica complementaria. como las formas cristalinas reclamadas en las reivindicaciones 6 y 7 se determinaron en polvo, es necesario adicionar una segunda prueba cristalográfica para que quede clara y completa la caracterización de dichos cristales.

Esta Oficina informa que la reivindicación 11 no es clara ni concisa, porque en primer lugar, refieren el compuesto de la composición como "en donde al menos una entidad es un antagonista de un receptor NMDA que contiene una subunidad NR2B" en donde están caracterizando el compuesto en función de la diana farmacológica; en segundo lugar,

Oficio N° 11443 de 22 de julio de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0008012

refieren “al menos una entidad”, lo que da a entender que hay varios principio activos, lo cual no está sustentado, y en tercer lugar, dado que no hay una diferenciación característica con respecto a la reivindicación 10 de la que depende, se considera que es una repetición de materia. Por lo tanto, se sugiere modificar la reivindicación, de tal forma que sea específica y diferenciable con respecto a la reivindicación de la que depende.

En consecuencia, es necesario que allegue las aclaraciones o modificaciones correspondientes para dar cumplimiento a lo establecido en el citado artículo.

5. Determinación del Estado de la Técnica

Se acepta la reivindicación de prioridad para las reivindicaciones 1 a 5 y 8 a 11; pero no para las reivindicaciones 6 y 7, porque éstas no están contenidas en la solicitud de patente sobre la cual se reivindica prioridad. Para las reivindicaciones 6 y 7, la fecha de determinación del estado de la técnica será la fecha de presentación internacional.

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 14 de noviembre de 2019, que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de 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	WO2009004430	N-benzyl oxazolidinones and related heterocycleic compounds as potentiators of glutamate receptors	8 de enero de 2009

D1¹ divulga compuestos de la fórmula (I) derivados de oxazolina, como potenciadores de receptores de glutamato, para el tratamiento de enfermedades del SNC (Resumen).

6. Examen de Patentabilidad

De acuerdo con lo establecido en el artículo 14 de la Decisión 486 de 2000 de la Comisión de la Comunidad Andina, en el cual se establecen los requisitos de patentabilidad objeto de la solicitud en estudio, esta Oficina presenta a continuación el análisis de los requisitos de patentabilidad.

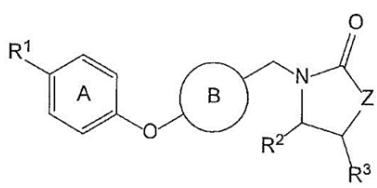
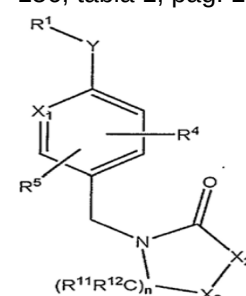
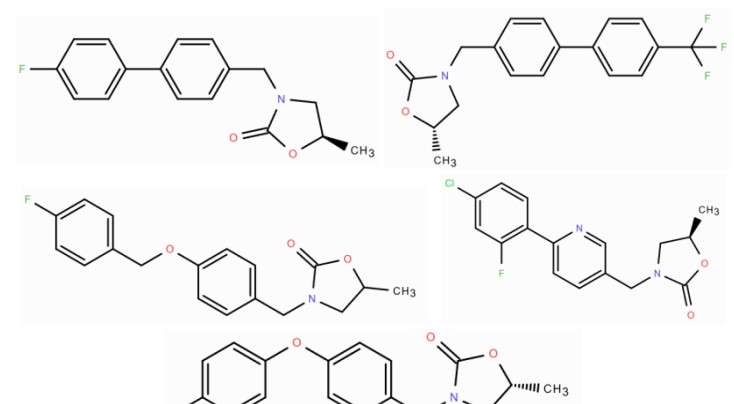
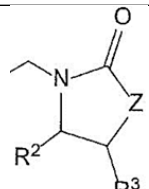
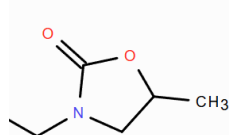
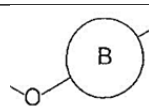
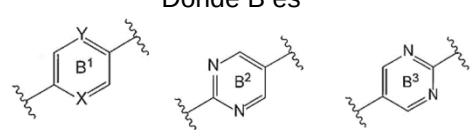
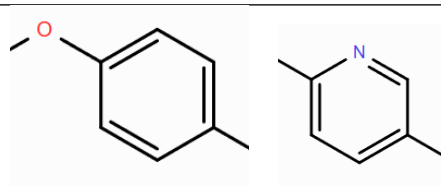
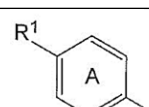
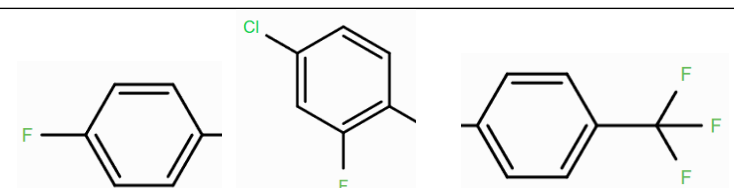
6.1. Nivel Inventivo

Teniendo en cuenta lo señalado en el artículo 18 de la Decisión 486 de 2000 de la Comisión de la Comunidad Andina, la reivindicación independiente 1 (NC2022/0017256 del 30 de noviembre de 2022) refiere a: “*Un compuesto de la fórmula (I) o una sal del mismo, en donde (...)*”. A continuación, se presenta la tabla comparativa entre el objeto reivindicado y los documentos encontrados en el estado de la técnica:

¹ <https://patents.google.com/patent/WO2009004430A1/en?q=WO2009004430>

Oficio N° 11443 de 22 de julio de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0008012

CARACTERÍSTICAS ESENCIALES	D1
Un compuesto de fórmula (I) 	Compuesto de fórmula I (Pág. 87 – 156, tabla 1; pág. 160, reiv. 1)  Compuestos específicos 61, 63, 110, 210 y 179 
 Donde Z es CH₂, CF₂, O y NH; R² es alquilo de C₁₋₃ opcionalmente sustituidos con uno a tres flúor; R³ es hidrógeno e hidroxilo	 Donde en la posición 4 hay el grupo metilo y en la posición 5 no está sustituido
 Donde B es  Donde X e Y son C o N	
 Donde R¹ es halógeno y grupos alquilo de C₁₋₃ opcionalmente sustituidos con al menos un flúor	

D1 es considerado como el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1, ya que divulga compuestos derivados de feniloxazolin-2-ona como inhibidores de receptores de glutamato mGluR2, para el tratamiento de enfermedades

Oficio N° 11443 de 22 de julio de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0008012

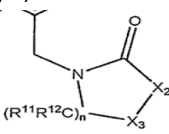
del sistema nervioso central tales como Alzheimer, Parkinson, epilepsia, esquizofrenia, entre otras (Pág. 87 – 156, tabla 1; pág. 160, reiv. 1).

La diferencia entre la invención definida entre la reivindicación 1 y el compuesto divulgado en D1, consiste en seleccionar los sustituyentes en el anillo de oxazolin-2-ona; mientras que en la invención propuesta R^2 es alquilo de C_{1-3} opcionalmente sustituidos con uno a tres flúor y R^3 es hidrógeno e hidroxilo, mientras que en los compuestos de D1 en la posición 4 hay el grupo metilo y en la posición 5 no está sustituido.

El efecto técnico asociado a esta diferencia en los sustituyentes corresponde a la especificidad de los compuestos de la solicitud sobre receptores NMDA para el tratamiento de enfermedades del sistema nervioso central.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿Cómo modificar el compuesto conocido en D1 con el fin de obtener compuestos que actúen sobre receptores NMDA?

Sin embargo, el mismo D1 refiere que en el anillo de oxazolina de los compuestos

divulgados , en donde X_2 es O; X_3 es CR^2R^3 (R^2 es H y R^3 es OR con R siendo H) y en la posición 5 está $R^{11}R^{12}$ (donde R^{12} y R^{13} son alquilo) (pág. 160, reiv. 1).

En consecuencia, la persona normalmente versada en la materia estaría motivada a seleccionar los sustituyentes e incluir las modificaciones del anillo de oxazolina sugeridas en D1, dentro de los mismos compuestos de D1, para así llegar al objeto de la reivindicación 1. Por lo cual se considera obvia.

Adicionalmente, es necesario mencionar que dentro del campo técnico de la farmacología del sistema nervioso central es completamente conocida la interrelación entre la potenciación (agonismo) de receptores de ácido glutámico (particularmente mGluR2/3) y la inhibición (antagonismo) de la actividad de los receptores de aspartato (particularmente NMDA) como estrategia en el manejo de algunas condiciones neurológicas, como por ejemplo, la esquizofrenia.²

Las reivindicaciones dependientes 2 a 4, 10 y 11 no mencionan alguna característica que, junto con las características de la reivindicación independiente, aporte nivel inventivo a los compuestos de la reivindicación 1, por lo cual se considera que carecen de nivel inventivo.

7. Conclusión

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

² Meng-Lin Li1, Xi-Quan Hu, Feng Li, and Wen-Jun Gao. Perspectives on the mGluR2/3 agonists as a therapeutic target for schizophrenia: still promising or a dead end? *Prog Neuropsychopharmacol Biol Psychiatry*. 2015. 60: 66–76. Disponible en : <https://pmc.ncbi.nlm.nih.gov/articles/PMC4426221/>

Oficio N° 11443 de 22 de julio de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0008012

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2009004430	1 a 4 y 10	Nivel inventivo

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de 2000, 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.

Si como respuesta a este requerimiento, el solicitante modifica el capítulo reivindicatorio, deberá observar las instrucciones contenidas en el numeral 1.2.2.1.1., del Capítulo Primero del Título X de la Circular Única de esta Superintendencia. De igual forma, deberá tener presente que de conformidad con el literal a) del numeral 1.2.2.5.1. de la norma ibidem, será necesario acreditar el pago de la tasa por concepto de modificación a solicitudes en trámites, de conformidad con el valor establecido en la resolución de tasas vigentes.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 6.2 del Capítulo Sexto del Título I de la Circular Única, informándoles que contra el mismo no procede recurso alguno en actuación administrativa.

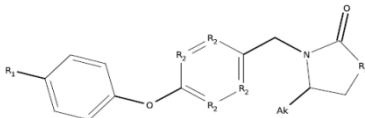


Sandra Isabel Calderon Rodriguez
DIRECTORA DE NUEVAS CREACIONES

Oficio N° 11443 de 22 de julio de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0008012

INFORME DE BÚSQUEDA
EXAMEN DE PATENTABILIDAD

Solicitud No. NC2022/0008012		Examen de patentabilidad							
		1°	X	2°		3°		Revoca	
Solicitud Internacional No. PCT/IB2020/000962		Fecha solicitud internacional: (DD/MM/AÑO) 12 de noviembre de 2020							
Fecha de determinación estado de la técnica (DD/MM/AÑO) 14 de noviembre de 2019				Prioridad X		Presentación			
Solicitante TAKEDA PHARMACEUTICAL COMPANY LIMITED									
Reivindicaciones que no son objeto de búsqueda por:									
Art. 14	-	Art. 15	-	Art. 20	-	Art. 25 (Falta de unidad de invención)		-	
CRITERIOS DE BÚSQUEDA									
Reivindicaciones objeto de búsqueda				1 – 11					
Palabras clave utilizadas				 NMDA antagonist and SNC diseases and oxazolin derivates					
Clasificaciones utilizadas para la búsqueda				CIP: C07D 207/263, C07D 401/06, C07D 403/06, C07D 413/06, A61P 25/28, A61P 25/06, A61K 31/4015					
DOCUMENTOS CONSIDERADOS RELEVANTES (Documentos patente, Literatura no patente (LNP): Artículos, catálogos, etc.)									
Informes de búsqueda / Bases de datos consultadas	N° de solicitud de patente / N° de patente / Autor LNP ⁽¹⁾	Fecha de Publicación /Presentación (DD/MM/AAAA)	Reivindicaciones /Secuencias afectadas	Citas relevantes del estado de la técnica				Categoría del documento citado ⁽²⁾	
SIPI	NC2021/0017142	15/12/2021	-	-				A, P	
	NC2017/0009989	29/09/2017	-	-				A	
	04113455	10/11/2004	-	-				A	
	96026135	23/05/1996	-	-				A	
EPO	EP1500658	26/01/2005	-	-				A	
	WO2009004430	08/01/2009	2 a 4, 10 y 11	Pág. 87, Tabla 1; pág. 160, reiv. 1				Y	
	EP1132379	12/09/2001	-	-				A	
USPTO	WO2007078523	12/07/2007	-	-				A	
PATBASE	US2006014800	19/01/2006	-	-				A	
	US2005165064	28/07/2005	-	-				A	
	JPS6445360	17/02/1989	-	-				A	
	WO2012063207	18/05/2012	-	-				A	
	WO0234726	02/05/2002	-	-				A	
	EP1583529	12/10/2005	-	-				A	
STNEXT	EP1134215	19/09/2001	-	-				A	
GOOGLE	Meng-Lin Li. 2015 ¹	03/07/2015	2 a 4, 10 y 11	Todo el artículo				Y	
⁽¹⁾ Cita completa literatura no patente (LNP)		1. Meng-Lin Li1, Xi-Quan Hu, Feng Li, and Wen-Jun Gao. Perspectives on the mGluR2/3 agonists as a therapeutic target for schizophrenia: still promising or a dead end? Prog Neuropsychopharmacol Biol Psychiatry. 2015. 60: 66–76							
⁽²⁾ Categorías de documentos citados									
“A” Documento que define el estado general de la técnica no considerado como particularmente relevante. “E” Solicitud de patente o patente anterior pero publicada en la fecha de presentación internacional o en fecha posterior. “L” Documento citado para llamar la atención sobre por ejemplo, dudas acerca de una reivindicación de prioridad o para determinar la fecha de publicación de otra cita, siempre van acompañados de una explicación, por la cual se citan. “O” Documento del tipo actas de conferencia, este tipo de documentos siempre estará acompañado por otra letra que indique la pertinencia del documento, por ejemplo, O,X, O,Y o bien O,A. “P” Documento publicado antes de la fecha de presentación internacional pero con posterioridad a la fecha de prioridad reivindicada. “T” Documento publicado en fecha posterior a la de presentación o la de prioridad de la solicitud internacional y no entra en conflicto con dicha solicitud, pero puede ser útil para la mejor comprensión del principio o teoría en que se basa la invención, o para demostrar que el razonamiento o los hechos en los que se basa dicha invención son incorrectos. “X” Documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse nueva o que implique una actividad inventiva por referencia al documento aisladamente considerado. “Y” Documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse que implique una actividad inventiva cuando el documento se asocia a otro u otros documentos de la misma naturaleza, cuya combinación resulta evidente para un experto en la materia.									
Fecha del reporte de búsqueda: 16 de julio de 2025									

