

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 11-28422- -10	FECHA: 2013-06-13 18:25:43
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 5
ACT: 519 PRESENTACION	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
CARLOS REINALDO OLARTE GARCIA

Asunto: Radicación: 11-28422- -10
 Trámite: 11
 Evento: 378
 Actuación: 519
 Oficio: 10509
 Folios: 5

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/EP2009/061024				
Fecha de Presentación Internacional	26/08/2009				

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 34 a 136	08/Marzo/2011
	Folios 151 a 257	08/Marzo/2011
Reivindicaciones:	Folios 136 a 148	08/Marzo/2011
	Folios 257 a 268	08/Marzo/2011
	Folios 278 a 286	13/Enero/2012
Dibujos:	Folios 34 a 136	08/Marzo/2011
	Folios 151 a 257	08/Marzo/2011
Prioridad:	EP 08163525.2	02/Septiembre/2008

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.

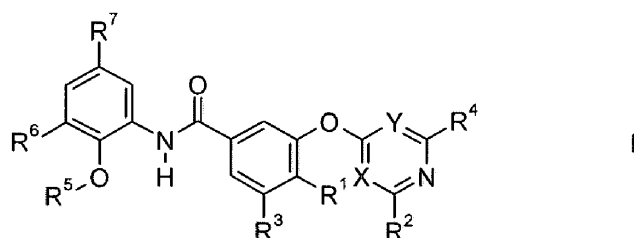
3. Objeto de la invención

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 17.

Título de la solicitud: “Nuevas Benzamidas, su preparación y su uso como medicamentos” .

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar heteroariloxi-amidas de ácido benzoico, que poseen actividad sobre la enzima p38 MAP-Quinasa y para el tratamiento de enfermedades de las vías aéreas, en especial EPOC y asma.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de la fórmula (I) y composiciones que lo contienen, caracterizado por ser heteroariloxi-amidas del ácido benzoico, de acuerdo a lo presentado en los folios 278 a 286.



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 213/68.

4. De la solicitud de patente

Título

El título no corresponde con el objeto de la solicitud porque es muy general, se sugiere ajustarlo a la materia que se reclama teniendo en cuenta los compuestos reclamados y

soportados en la descripción, además no debe aparecer la expresión “y su uso como medicamentos”.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 14 no es clara porque reclama una sal de tolerancia fisiológica de acuerdo a la reivindicación 30. El nuevo capítulo reivindicatorio tan sólo tiene 17 reivindicaciones.

Las reivindicaciones 1 a 12 no son concisas porque las definiciones de R1, R2, R3, R4, R5, R6 Y R7 se describen en términos de géneros funcionales. Se sugiere restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que han sido sintetizados ó probados, es decir, que se encuentran debidamente sustentados en la descripción, de acuerdo a lo presentado en la tabla No1.

Tabla 1. Radicales definidos en el capítulo descriptivo.

RADICAL	SOPORTE DE LOS EJEMPLOS PRESENTADOS
R ¹	Metil, etil, metoxi, trifluorometil, cloro, fluor, bromo
R ²	Hidrógeno
R ³	Hidrógeno, cloro, fluor, metil
R ⁴	Dimetilamino, etilamino, metilamino, pirrolidin, oxo-piperazina, morfolin, piperidina, metil, carbonil, metil fenoxi
R ⁵	Metoxi, etoxi, isopropoxi
R ⁶	Alcohol, sulfamina, metasulfonil, ciclopropilaminas, pirrolidin, dimetilaminas, butirilaminas, pentanoaminas, butan sulfanaminas, propan-2-2ulfonilaminas
R ⁷	Alquilo, tec-Butil, trifluorometil, pentanofluoroetil

Las reivindicaciones 16 y 17 no son claras porque la expresión: “opcionalmente”, precediendo una característica no es limitativo, porque hace variable a la característica y no precisa el alcance de la reivindicación. Se sugiere incluir las características opcionales o preferentes en una reivindicación dependiente.

La reivindicación 15 menciona un procedimiento pero este no se define mediante características como alguna etapa ó alguna condición específica en que debiera realizarse. Se sugiere, entonces, definir el procedimiento por sus características esenciales.

Se requiere al solicitante hacer las aclaraciones necesarias.

5. Determinación del Estado de la Técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de prioridad: septiembre 2 de 2008. 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	US 2007/0142440	"Pyridinamide derivatives as kinase inhibitors"	21/06/2007
D2	EP 1 777 225	"Fused benzamide compound and vanilloid receptor 1 (VR1) activity inhibitor"	25/04/2007

El documento D1⁽¹⁾ divulga compuestos derivados de las arilamidas sustituidas de fórmula (I), su preparación y el uso de estos para la preparación de medicamentos en el tratamiento de tumores y enfermedades causadas por estos; estos compuestos son efectivos como inhibidores de la tirosina quinasa, en particular de la TIE-2 y VEGFR, y de la Raf quinasa (Pág. 1, líneas 4-12).

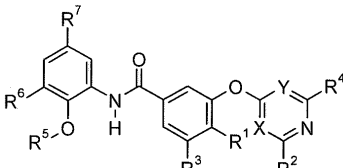
El documento D2⁽²⁾ divulga compuestos de benzamida fusionados, que presentan actividad en el receptor subtipo (VR1) y son muy efectivos para el tratamiento de enfermedades como EPOC y asma (Pág. 4, líneas 37-44).

6. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en un compuesto Heteroariloxi-amidas de ácido benzoico sustituidas de la fórmula general (I), que contiene las siguientes características: R1 es L1-R8, R2 es L2-R9, R3 es L3-R10, Hal puede ser flúor o cloro, R1 hidrógeno, R2 hidrógeno (Folio 278)

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

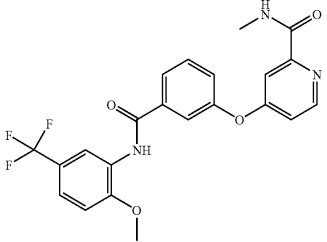
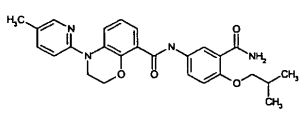
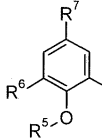
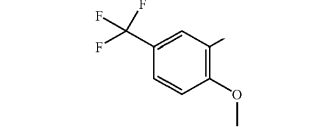
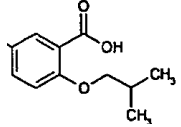
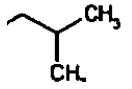
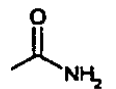
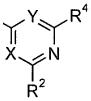
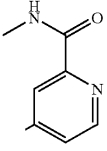
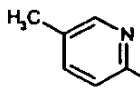
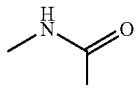
Características esenciales	D1	D2
Heteroariloxi-amidas de ácido benzoico sustituidas de la fórmula general (I): 	(16) Compuesto N-metil-4-[3-(2-metoxi-5-trifluorometilfenilcarbamoil)-fenoxy]piridina-2-carboxamida	(75) N-(3-carbamoil-4-isobutioxifenil)-4-(5-metilpiridina-2-il)-3,4-dihidro-2H-benzo[1,4]oxacinz-8-carboxamida (Pág. 142, líneas 23-24)

1. [http://patentscope.wipo.int/search/en/detail.jsf?](http://patentscope.wipo.int/search/en/detail.jsf?docId=WO2005085202&recNum=1&tab=PCTDocuments&maxRec=&office=&prevFilter=&sortOption=&queryString=)

docId=WO2005085202&recNum=1&tab=PCTDocuments&maxRec=&office=&prevFilter=&sortOption=&queryString=

2. [http://patentscope.wipo.int/search/en/detail.jsf?](http://patentscope.wipo.int/search/en/detail.jsf?docId=EP14723786&recNum=1&docAn=05766173&queryString=FP:(EP1777225)&maxRec=1)

docId=EP14723786&recNum=1&docAn=05766173&queryString=FP:(EP1777225)&maxRec=1

Dónde:	 (Pág. 20, compuesto 16)	 (Pág. 89, compuesto 75)
	 (Pág. 20, compuesto 16)	 (Pág. 89, compuesto 75)
R5= alquilo C1-6	 (Pág. 20, compuesto 16)	 (Pág. 89, compuesto 75)
R6= L5-R12 siendo: L5= enlace, CONH R12= alquilo C1-6	No existe	 (Pág. 89, compuesto 75)
R7= trifluorometilo	 (Pág. 20, compuesto 16)	No existe
R3= L3-R10 siendo: L3= enlace y R10= hidrógeno	Hidrógeno (Pág. 20, compuesto 16)	Hidrógeno (Pág. 89, compuesto 75)
R ¹ = L1-R8, siendo: L1= enlace y R8= hidrógeno	Hidrógeno (Pág. 20, compuesto 16)	Hidrógeno (Pág. 89, compuesto 75)
 X y Y= CR13, siendo R13= hidrógeno	 (Pág. 20, compuesto 16)	 (Pág. 89, compuesto 75)
R2= L2-R9 siendo: L2= enlace y R9= hidrógeno	Hidrógeno	Hidrógeno
R4= L4-R11 siendo: L4= CO, enlace y R11= alquilo C1-6, dialquilamino C1-6	 (Pág. 20, compuesto 16)	CH3 (Pág. 89, compuesto 75)

Los documentos D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención

definida en la reivindicación 1, porque D1 divulga el compuesto (16) N-metil-4-[3-(2-metoxi-5-trifluorometilfenilcarbamoil)-fenoxy]piridina-2-carboxamida (Pág. 20, compuesto 16), demostrando estos compuestos valores de IC50 de 0.01-5.0 μ M que demuestra inhibición de la tirosina kinasa (Pág. 25, (0282)) y D2 divulga un compuesto (75) N-(3-carbamoil-4-isobutiloxifenil)-4-(5-metilpiridina-2-il)-3,4-dihidro-2H-benzo[1,4]oxacina-8-carboxamida (Pág. 89, compuesto 75).

La diferencia entre la invención definida en el compuesto de la fórmula (I) y el compuesto del documento D1, consiste en que el compuesto reivindicado de fórmula I presenta en la posición meta de la acetamida para el radical R6 una amida y el compuesto (16)N-metil-4-[3-(2-metoxi-5-trifluorometilfenilcarbamoil)-fenoxy]piridina-2-carboxamida definido en el documento D1 carece del mismo.

El efecto que se logra al incluir en la posición meta de la acetamida para el radical R6 una amida, consiste en mejorar la acción inhibitoria sobre la enzima p38 MAP-quinasa y la mejora en las propiedades farmacológicas y/o farmacocinéticas apropiadas para poderlas utilizar en el tratamiento de enfermedades aéreas, en especial de EPOC y asma; presentando estos compuestos una actividad inhibitoria de 1 μ M (folio 177, tabla 2).

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “¿cómo proveer compuestos que mejoren la acción inhibitoria sobre la enzima p38 MAP-quinasa?”

Sin embargo, aunque el compuesto de fórmula (I) del documento D1 no presenta en la posición meta de la acetamida una amida para el radical R6, el documento D2 divulga en la misma posición una amida (Pág. 89, compuesto 75).

Es importante mencionar que en el capítulo descriptivo de la presente solicitud se enseñan resultados asociados a la actividad inhibitoria sobre la enzima p38 MAP-quinasa de los compuestos reclamados, presentando estos compuestos una actividad inhibitoria de 1 μ M (folio 177, tabla 2). Al ser comparados estos resultados con los compuestos definidos en el documento D1, estos presentan una actividad inhibitoria entre un rango de IC50 de 0.01-5.0 μ M (Pág. 25, [0282], líneas 7-8).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría la amida en la posición meta de la acetamida (Pág. 89, compuesto 75) divulgado en el documento D2, en el compuesto definido en el documento D1 para llegar así a los compuestos de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2-14 no mencionan ninguna característica que haga nuevos a los compuestos de la reivindicación 1, tampoco se pueden considerar inventivas.

7. Conclusión

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

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	US 2007/0142440	1 – 14	Nivel Inventivo
D2	EP 1 777 225	1 – 14	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.

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 2013-06-18

Elaboró: German Antonio Clavijo Cohen

Revisó: Consuelo Leguizamon Leguizamon