

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

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
275 **CARLOS R. OLARTE**

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 03-009984- -00006-0000

Fecha: 2008-04-03 14:21:41 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 519 TRASLADOINFORME Folios: 1

ASUNTO

Radicación 03-9984
Trámite 011
Evento 379
Actuación 430
Oficio ^{mai} 4657
Folios 012

Patente de Invención ☒ Patente de Modelo de Utilidad ☐

Vía Nacional ☐

Vía PCT (fase nacional) ☒ Cap.I ☐ Cap. II ☒

No. Sol. Internacional PCT/GB01/03544

Fecha de Presentación Internal. Agosto/07/2001.

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 le comunica:

1. Documentos estudiados

- 1.1. Descripción: Folios: 86 a 181 (como se radicó inicialmente)
- 1.2. Reivindicaciones: Folios 182 a 193 (como se radicó inicialmente)
Folios 256 a 274 (modificado)
- 1.3. Prioridad: 07/08/2000,GB,0019410.0.
08/08/2000,GB,0019523.0.
02/08/2001,GB,0118919.0.
03/08/2001,GB,0119022.2

2. Objeto de la invención

Título de la solicitud: **EL USO DE ANTAGONISTAS DE RECEPTORES DE LA 5HT4 EN LA PROFILAXIS O TRATAMIENTO DE CIERTAS CONDICIONES CARDIOVASCUALRES.**

Reivindicaciones 1–59: Usos del compuesto N-[(1-ⁿbutil -4-piperidinil)metil]-3,4-dihidro-2H-[1,3]oxazino[3,2-a]indol-10-carboxamida (SB 207266).

Reivindicaciones 60-106,118: Composiciones farmacéuticas que contienen el compuesto N-[(1-ⁿbutil -4-piperidinil)metil]-3,4-dihidro-2H-[1,3]oxazino[3,2-a]indol-10-carboxamida (SB 207266).

Reivindicaciones 107-117: Proceso de fabricación de las composiciones farmacéuticas.

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de compuestos y composiciones útiles para tratar ciertas condiciones cardiovasculares como fibrilación cardiovascular, remodelación auricular.

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio proporciona el compuesto N-[(1-ⁿbutil -4-piperidinil) metil]-3,4-dihidro-2H-[1,3]oxazino[3,2-a]indol-10-carboxamida (SB 207266) y sus sales farmacéuticamente aceptables.

Clasificación Internacional de Patentes (IPC.) C07D401/12; A61K9/16; A61K9/20; A61K31/453; A61K31/454; A61K31/5365; A61K45/00.

3. De la solicitud de Patente (según el caso)

3.1. Descripción (artículo 28 D. 486)

En la descripción, la tabla 1 (folio 157, pg 72) muestra resultados de episodios de fibrilación auricular en donde se hace la comparación de unos animales tratados con vehículo y otros con el compuesto (SB 207266), pero no se observa la ventaja comparativa pretendida por el solicitante frente a las demás composiciones similares del estado de la técnica, ya que no se presenta estudio comparativo alguno, lo cual no permite evidenciar el salto inventivo de las composiciones reivindicadas por el solicitante.

3.2. Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

Las reivindicaciones 60-70, están caracterizadas por un uso.

La materia a proteger en la reivindicación 61 esta comprendida en la reivindicación 60, se debe hacer la aclaración pertinente.

La reivindicación 71, es un compuesto y esta caracterizada por el proceso de obtención de la composición.

Las reivindicaciones 71-104, están presentadas como independientes, siendo que es la misma materia de la reivindicación 60

Las reivindicaciones 105 y 106, están caracterizadas, remitiendo a ejemplos de la descripción, mostrando que no son claras por si mismas.

La reivindicación 117, es Un proceso y esta caracterizada por un compuesto.

La reivindicación 118, es una composición y esta caracterizada por un proceso.

Se requiere al solicitante tomar en cuenta las observaciones citadas y caracterizar las reivindicaciones conforme a los requisitos de claridad y concisión, a que se refiere el artículo citado.

4. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso (artículos 14 y 21 D 486)

Las reivindicaciones de 1-59, se refieren a usos del compuesto N- [(1-ⁿbutil -4-piperidinil) metil]-3,4-dihidro-2H-[1,3] oxazino[3,2-a] indol-10-carboxamida (SB 207266); las cuales no son patentables de acuerdo al presente artículo.

5. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha que se ha tenido en cuenta para determinar el Estado de la Técnica es:

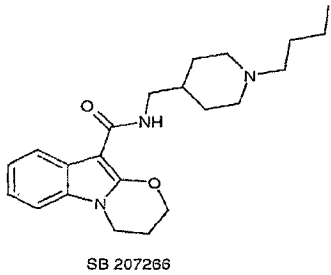
Fecha de presentación de la solicitud prioritaria: Agosto, 07 DE 2000.

Nº	Documento	Título	Fecha de publicación*
D1	US5998409	Condensed Indole derivatives as 5HT ₄ receptor antagonists	Diciembre 07/1999
D2	*Libro	Farmacia Remington 19 edición, tomo 2 pgs 2481-2486 ; 2473- 2478) y 2500	1995

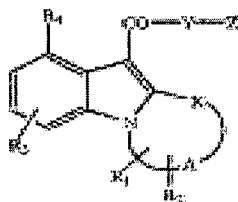
6. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

6.1 Novedad (artículo 16 D486)

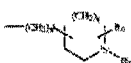
La reivindicación 60 y sus dependientes 62-70: Se refieren a composiciones farmacéuticas, en forma de tabletas, que contienen el compuesto N- [(1-ⁿbutil -4-piperidinil) metil]-3,4-dihidro-2H-[1,3] oxazino[3,2-a] indol-10-carboxamida (SB 207266) en cantidad de 20,25,40,50 ó 80 mg , útiles para tratar ciertas condiciones cardiovasculares como fibrilación cardiovascular, remodelación auricular, dicho compuesto esta en forma de base representado por la fórmula (I):



El compuesto N- [(1-ⁿbutil -4-piperidinil) metil]-3,4-dihidro-2H-[1,3] oxazino [3,2-a] indol-10-carboxamida (SB 207266), se obtiene de la formula general (I):



Cuando R1 y R2 son H, A= cadena satura de metileno de 3 carbonos, X=O, R3 y

R4=H, Y= NH; Z=  , n=1, R6=H, q=1, R5= C4 alquil.

Teniendo en cuenta lo anterior, la novedad de las citadas composiciones farmacéuticas se ven afectadas por **D1** (folio 281 , abstract , folio 284, columna 5, renglones 14-17), que se refiere a composiciones farmacéuticas que contienen el compuesto (SB 207266), para ser administradas por vía oral como tabletas, cápsulas, polvos entre otras formas farmacéuticas (folio 284, columna 5, renglones 18-25), mezclado con excipientes como almidón glicolato, estearato de magnesio, celulosas (folio 284, columna 5, renglones 26-37), en cantidades de 0.05 a 1000mg(folio 284, columna 6, renglones 30-32).

Las reivindicaciones 71-78, 81-94, 100-102:

Se refieren a una tableta que contiene 5.0 mg de N- [(1-ⁿbutil -4-piperidinil) metil]-3,4-dihidro-2H-[1,3] oxazino[3,2-a] indol-10-carboxamida (SB207266) en combinación con un vehículo farmacéuticamente aceptable, en donde el principio activo o su sal están en cantidad de 5.0 mg, las cuales se afectan por novedad igualmente por **D1**.

6.2 Nivel inventivo (artículo18 D486)

Las reivindicaciones 79-80, 103-104: Se refieren a composiciones farmacéuticas en forma de tableta que contienen el compuesto, 5.0 mg de N- [(1-ⁿbutil -4-piperidinil) metil]-3,4-dihidro-2H-[1,3] oxazino[3,2-a] indol-10-carboxamida (SB 207266), diluyentes como sales de calcio, aglomerantes como celulosas, desintegrantes, lubricantes y solventes.

Dichas composiciones se ven afectadas por el siguiente documento más cercano encontrado en el estado de la Técnica: **D1**, que enseña composiciones en forma de tabletas que sirven para el mismo propósito que la invención reivindicada, útiles para tratar ciertas condiciones cardiovasculares como fibrilación cardiovascular, remodelación auricular, (Ver folio: 281, abstract).

La diferencia con la presente solicitud es que estas reivindicaciones mencionan como entre otros componentes (excipientes) como fosfato de calcio dibásico y fosfato de hidrógeno de calcio dihidrato, los cuales son equivalentes farmacéuticos a los muy conocidos: manitol y lactosa mencionados y otros similares (**D1**, folio 281, columna 5, renglones 32-33, columna y **D2** Pgs 2473-2478); pero esto no parece conceder un efecto técnico inesperado porque las composiciones reivindicadas conservan la misma actividad que las divulgadas en **D1**. En la descripción, la tabla 1 (folio 157, pg 72) muestra resultados de episodios de fibrilación auricular en donde se hace la comparación de unos animales tratados con vehículo y otros con el compuesto (SB 207266), **pero no se observa la ventaja comparativa pretendida**

por el solicitante frente a las demás composiciones similares del estado de la técnica, ya que no se presenta estudio comparativo alguno, lo cual no permite evidenciar el salto inventivo o efecto técnico de las composiciones reivindicadas por el solicitante.

El Problema Técnico Objetivo fundamental de la Invención Reivindicada que es la necesidad de composiciones útiles para tratar ciertas condiciones cardiovasculares como fibrilación cardiovascular, remodelación auricular, ya había sido resuelto por las composiciones presentados en **D1**.

Conforme a lo anterior el experto en la materia podría llegar a obtener otras composiciones que contengan el mismo principio activo (SB 207266) y los excipientes fosfato de calcio dibásico y fosfato de hidrógeno de calcio dihidrato, a partir de **D1**, motivado por la obtención de compuestos útiles para tratar ciertas condiciones cardiovasculares como fibrilación cardiovascular, remodelación auricular; al efectuar diferentes cambios al variar algunos excipientes, como las que sugiere el solicitante.

En la descripción, la tabla 1 (folio 157, pg 72) muestra resultados de episodios de fibrilación auricular en donde se hace la comparación de unos animales tratados con vehículo y otros con el compuesto (SB 207266), pero no se observa la ventaja comparativa pretendida por el solicitante frente a las demás composiciones similares del estado de la técnica, ya que no se presenta estudio comparativo alguno, lo cual no permite evidenciar el salto inventivo de las composiciones reivindicadas por el solicitante.

Por lo anterior las composiciones reivindicadas en esta solicitud se consideran una alternativa a las conocidas en el estado de la técnica útiles para tratar ciertas condiciones cardiovasculares como fibrilación cardiovascular, remodelación auricular, sin un efecto sorprendente, que las haga superiores a las composiciones previamente conocidas en **D1** (Ver folio: 281, columna 5, renglones 13-30).

Las reivindicaciones 107-117: Se refieren a un proceso de obtención de composiciones farmacéuticas en forma de tabletas, por granulación húmeda, que contienen como principio activo el compuesto N- [(1-ⁿbutil -4-piperidinil) metil]-3,4-dihidro-2H-[1,3] oxazino[3,2-a] indol-10-carboxamida (SB 207266) ó su sal y comprende las etapas de: granulación, secado, tamizado y compresión de las tabletas.

Este proceso de obtención se ve afectado por **D2** (pgs 2481-2486), ya que el proceso de granulación húmeda divulgado en este, comprende las etapas del proceso reclamado en las reivindicaciones citadas: granulación, secado, tamizado y compresión de las tabletas. Igualmente **D1** (folio 284, columna 5, renglones 62-67), enseña que las composiciones farmacéuticas para ser administradas por vía oral, pueden ser preparadas por métodos convencionales, tales como: mezclado, llenado ó **tableteado**.

De acuerdo al análisis anterior las composiciones de las reivindicaciones **79-80, 103-104, 88-90, 93, 103, 101,104**, de la presente solicitud, no tienen nivel inventivo al igual que el proceso de obtención, reclamado en las reivindicaciones **107-117**.

7. Conclusión:

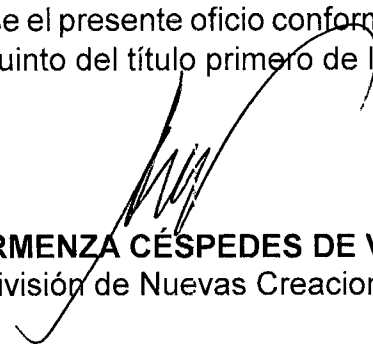
Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

N°	Documento N°	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	US5998409	60, 62-70, 71-78, 81-94, 100-102.	Novedad
		79-80, 103, 104, 107-117	Nivel Inventivo
D2	*Libro	79-80, 103, 104, 107-117	Nivel Inventivo

* Farmacia Remington 19 edición tomo 2 pgs 2481-2486 y 2500; 1995.

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 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.

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 N° 10 de 2001.


ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de División de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 4 ABR. 2008

CONCEPTO TÉCNICO No.815	EXAMINADOR TÉCNICO Código No.202078
--------------------------------	---

