

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.

Abogada
✓ ALICIA LLOREDA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 03-029593- -00006-0000

Fecha: 2008-05-29 11:52:14 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 519 TRASLADOINFORME Folios: 1

ASUNTO Radicación 03-29593
 Trámite 011
 Evento 379
 Actuación 430
 Oficio 7026
 Folios 018

Patente de Invención ☒ Patente de Modelo de Utilidad ☐
Vía Nacional ☐
Vía PCT (Fase Nacional) ☒ Cap. I ☐ Cap. II ☒

No. Sol. Internacional PCT/US01/42564
Fecha de Presentación Internacional. 09/10/2001

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

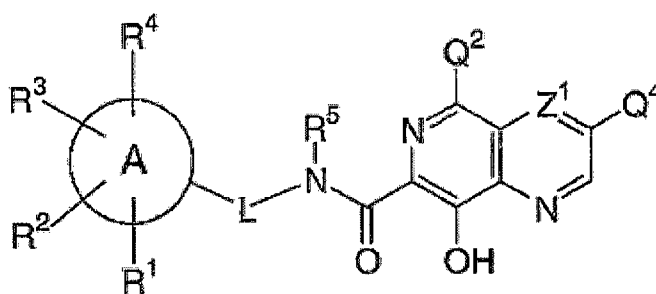
- 1.1. Descripción: Folios 60 a 141 y modificaciones folios 190 a 195.
- 1.2. Reivindicaciones: Folios 196 a 220 modificado.
- 1.3. Prioridad: Folio 1 US 60/239,707 del 12/10/00 y US 60/281,656 del 05/04/01.

2. Objeto de la invención

Título de la solicitud: AZA Y POLIAZA-NAFTALENIL CARBOXAMIDAS UTILES COMO INHIBIDORES DE INTEGRASA VIH.

Objeto de la invención:

El objeto de la presente solicitud se ocupa de aza y poliaza-naftalenil carboxamidas de fórmula general (I) y composiciones farmacéuticas de los mismos como inhibidores de la enzima integrasa del VIH.



Reivindicaciones 1 a 7: Compuestos de fórmula (I).

Reivindicación 8: Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de fórmula (I) y un portador farmacéuticamente aceptable.

El problema planteado en esta solicitud de patente es la necesidad de proveer nuevos compuestos y composiciones farmacéuticas con actividad inhibidora de la enzima integrasa del VIH que puedan ser utilizados en trastornos ocasionados por el VIH.

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio proporciona compuestos de fórmula (I) y composiciones farmacéuticas de los mismos.

Se catalogó el objeto de la invención según la IPC en las categorías C07D 471/04, A61K 31/4375, A61P 31/12.

3. De la solicitud de Patente

3.1. Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

Los sustituyentes de la fórmula (I) de la reivindicación 1 representan una gran cantidad de compuestos diferentes, así, es posible generar un número muy elevado de compuestos, con lo cual no se estaría delimitando de manera concisa la materia que se desea proteger en esta solicitud de patente de acuerdo a lo sustentado en el capítulo descriptivo.

4. Determinación del Estado de la Técnica

Considerando que la fecha de presentación de la primera solicitud de patente de la cual se reivindica prioridad es 11/01/2001, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

N°	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	WO 97/34894	Naphthyridine derivatives and their analogues inhibiting cytomegalovirus	23/09/1997
D2	*Artículo	Antiviral properties of a series of 1,6-naphthyridine and 7, 8-dihydroisoquinoline derivatives exhibiting potent activity against human cytomegalovirus.	30/04/2000

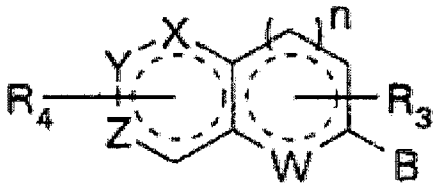
* *Antimicrobial Agents and Chemotherapy*. Apr. 2000; 44(4):929-37

5. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D 486)

Se procedió a evaluar los requisitos de novedad, nivel inventivo y aplicación industrial con el fin de establecer la patentabilidad de la invención reivindicada en la solicitud en estudio.

5.1. Nivel Inventivo: (artículo 18 D 486)

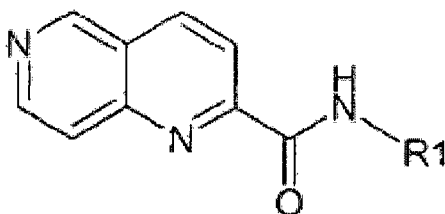
El estado de la técnica más cercano es el documento D1, el cual describe derivados de Naftiridinas de fórmula:



Al realizar los respectivos reemplazos de W, X, Y y Z, se obtienen 1,6-Naftiridinas muy similares a las de la fórmula (I) de la solicitud en estudio. Estos compuestos también tienen actividad antiviral y son útiles en profilaxis y tratamiento de infecciones con citomegalovirus, herpes y VIH. Los compuestos reivindicados en la actual solicitud solo se diferencian de los descritos en D1 en la posición y el sustituyente de la carboxamida (sustituyente B) y en los sustituyentes del núcleo básico de 1,6-Naftiridina.

Los ejemplos descritos en D1 en la tabla 1 (página 55) muestran la similitud de estos compuestos con los de la presente solicitud, así, el ejemplo número 8 corresponde al N-(4-clorobenzil)-(1,6)-naftiridin-2-carboxamida, el cual es muy similar al compuesto N-(4-clorobenzil)-8-hidroxi-(1,6)-naftiridin-7-carboxamida citado como ejemplo en el capítulo descriptivo de la solicitud en estudio (folio 78), donde las diferencias solo son el radical 8-hidroxi y la posición de la carboxamida.

El documento D2, describe 1,6-Naftiridinas sustituidas de fórmula:



Estos compuestos también tienen actividad antiviral con mecanismos de inhibición de la replicación de virus como el citomegalovirus humano y el VIH. La estructura de estos compuestos es muy similar a los de la fórmula (I) de la presente solicitud, pues solo se diferencian en los sustituyentes del núcleo básico de la 1,6-Naftiridina y en la posición del sustituyente que forma la carboxamida, el cual se encuentra en D2 en el carbono de la posición 2 y no en la posición 7.

Además de la similitud estructural y de presentar propiedades farmacológicas similares, la actividad de los compuestos descritos en D2 fue evaluada con diferentes ensayos que demostraron su efectividad y especificidad, tales como los ensayos de citotoxicidad, ensayos de actividad antiviral y de combinaciones con otros fármacos antivirales, los cuales no se mencionan en el capítulo descriptivo de la presente solicitud para los compuestos reivindicados.

Los ensayos de actividad de los compuestos descritos en D2 para el HIV, muestran valores de CI_{50} inferiores a 31 μM . En contraste, la solicitud en estudio no presenta datos que demuestren efectividad de los compuestos o una mayor eficacia con respecto a los de D2 ya que el valor de CI_{50} mencionado en la descripción (folio 141) es de 100 μM .

Las diferencias estructurales de los compuestos reivindicados con los descritos en D1 y D2 no parecen concederle a los compuestos de fórmula (I) un efecto técnico inesperado, ventaja o mejoría con respecto a los presentes en el estado de la técnica, ya que siguen siendo útiles como antivirales en el tratamiento del VIH y no se presentan datos que demuestren mayor efectividad y/o eficacia de los compuestos reivindicados en la presente solicitud con respecto a los del arte previo, por lo tanto se les puede considerar compuestos alternativos a los ya conocidos.

Teniendo en cuenta el problema técnico de la actual solicitud, el cual es proveer compuestos y composiciones farmacéuticas con actividad inhibidora de la enzima integrasa del VIH que puedan ser utilizados en el tratamiento de trastornos ocasionados por el VIH, vemos que la información de las anterioridades citadas le sugieren al experto en la materia, con sus conocimientos generales, sintetizar compuestos similares con actividad antiviral y solucionar así este problema técnico de manera obvia, por lo tanto el objeto reivindicado carece de nivel inventivo.

6. Conclusión

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

N°	Documento	Reivindicaciones Afectadas	Requisito que Afecta
D1	WO 97/34894	1 a 8	Nivel Inventivo
D2	*Artículo	1 a 8	Nivel Inventivo

* *Antimicrobial Agents and Chemotherapy. Apr. 2000; 44(4):929-37*

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
30 MAYO 2003

CONCEPTO TECNICO No. 705	EXAMINADOR TECNICO Código No. 202077
--------------------------	---

vpck3