

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO			
RAD:	11-144548- -7	FECHA:	2013-01-29 15:51:40
DEP:	2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE:	378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA:	11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS:	6
ACT:	519 PRESENTACION		

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
LUZ CLEMENCIA DE PAEZ
cavelier@cavelier.com

Asunto: Radicación: 11-144548- -7
 Trámite: 11
 Evento: 378
 Actuación: 519
 Oficio: 1526
 Folios: 6

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/JP2010/055257				
Fecha de Presentación Internacional	25/03/2010				

1. Documentos estudiados

Descripción:	Folios 19 a 102	Octubre 26 de 2011
Reivindicaciones	Folios 103 a 106	Octubre 26 de 2011
Prioridad:	JP 2009-077078	Marzo 26 de 2009

2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de Prioridad porque esta 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

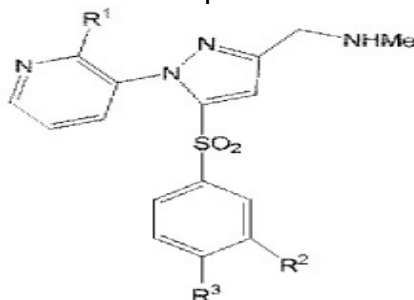
De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del Capítulo Primero del Título 10 de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por el solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es que cuando la solicitud contenga más de diez (10) reivindicaciones y no se haya pagado la tasa complementaria, sólo se estudiarán las cubiertas por la tasa pagada.

Por lo tanto, las reivindicaciones 11 a 16 visibles en los folios 104 a 106 son aceptadas para ser estudiadas, porque se registra el pago por dichas reivindicaciones adicionales, de acuerdo con el recibo presente en el folio 117.

Título de la solicitud: “compuestos de pirazol”

El problema planteado en esta solicitud consiste en la obtención de compuestos alternativos inhibidores de la bomba de protones Na^+/H^+ ATP asa, para el tratamiento de ulcera péptica y de enfermedades gástricas dependientes de la excesiva producción de ácido en el estómago.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio plantea la obtención de compuestos derivados de pirazol, con actividad inhibidora de la bomba de protones Na^+/H^+ ATP asa, para el tratamiento de ulcera péptica y de enfermedades relacionadas con la sobreproducción de ácido en el estómago.



El objeto de la presente Solicitud reporta Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K31/4439; A61P1/04; C07D401/04.

4. Excepción a la Patentabilidad (Art 20 D 486, literal d)

El objeto de la reivindicación 15 no es patentable, de acuerdo con el artículo citado.

5. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso (Art 14 y 21 D 486)

El uso de las reivindicaciones 12 a 14 y 16 no es patentable, de acuerdo con el artículo 14.

6. De la Solicitud de la Patente

Título

El título de esta solicitud se considera muy general y no ilustra detalladamente el objeto de la invención. Se observa que el objeto de esta invención corresponde a los compuestos derivados de 1 – (piridin – 3 – il) – 3 – metil aminometil – 5 – fenil sulfonil pirazol. Se solicita corregir el título de manera que se mencione el objeto de esta invención.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 se considera imprecisa, porque se menciona que “ R^1 es un sustituyente” pero no se define cuál o cuáles. Se solicita mencionar que sustituyentes pueden ser R^1 .

Para esta misma reivindicación se solicita mencionar los sustituyentes específicos, dado que al mencionar los sustituyentes como “alquilo C_{1-6} ” o “alcoxi C_{1-6} ” se pueden obtener muchos compuestos (en este caso se solicita especificar si dicho alquilo C_{1-6} corresponde a metil, etil, isopropil, pentil o si un alcoxi C_{1-6}

corresponde a metoxi, etoxi, tercbutoxi, pentoxi). Se sugiere limitar los sustituyentes de acuerdo a lo soportado en de capítulo descriptivo y se muestran en la siguiente tabla:

Sustituyente	Soportado en la descripción
R ¹	F
R ²	H, CH ₃ , Br, CN
R ³	H, F, OCH ₃

De igual manera, se solicita realizar dichas restricciones para las reivindicaciones 3 a 5, de acuerdo a lo planteado con la reivindicación 1.

Para la reivindicación 11 se solicita mencionar específicamente que profármaco debe integrar el objeto de esta invención, puesto que existen muchísimas posibilidades existentes de profármaco que amplían los posibles compuestos a obtener.

Para la reivindicación 12, se solicita cambiar la expresión “medicamento” por la expresión “composición farmacéutica” que constituye el término técnico más preciso para mencionar la mezcla que integra los compuestos de esta invención mas los excipientes.

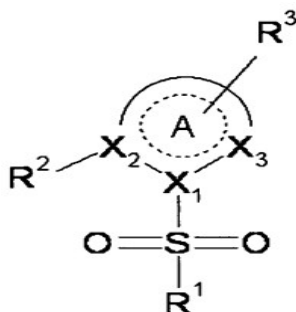
6. Determinación del Estado de la Técnica

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, el 26 de marzo de 2009.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontró el siguiente documento que anticipa el objeto de esta solicitud.

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	EP2005957	“Acid secretion inhibitors”	Diciembre 24 de 2008

El documento D1¹ divulga compuestos derivados de sulfonil heterociclos con actividad inhibidores de la bomba de protones Na⁺/H⁺ ATP asa, para el tratamiento de ulcera péptica y de enfermedades relacionadas con la sobreproducción de acido en el estomago.



7. Examen de Patentabilidad.

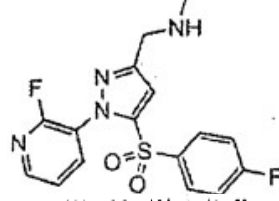
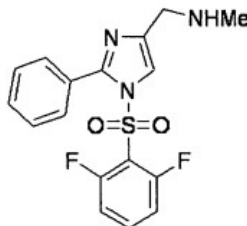
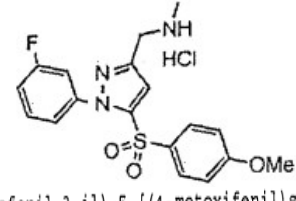
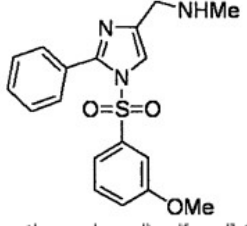
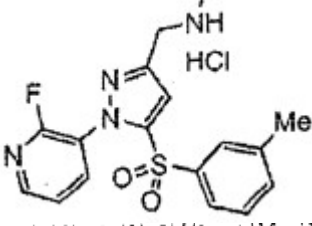
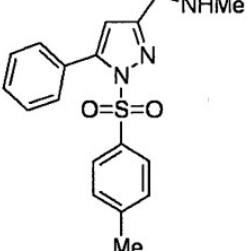
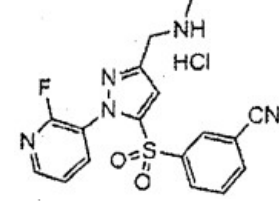
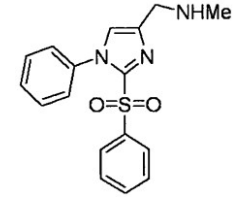
Nivel inventivo (Art 18 D 486)

La reivindicaciones 6 a 9 divulgan compuestos caracterizados porque son... (Folio 104, líneas 10 a 22)

¹[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?FT=D&date=20081224&DB=EPODOC&locale=en_EP&CC=EP&NR=2005957A1&KC=A1&ND=2)

FT=D&date=20081224&DB=EPODOC&locale=en_EP&CC=EP&NR=2005957A1&KC=A1&ND=2

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Solicitud	D1
Compuesto de la Reivindicación 6  <chem>CN(C)Cc1cc2c(cc1n2)nc3cc(F)ccn3</chem> 1-({5-[(4-fluorophenyl)sulfonyl]-1H-pyrazol-3-yl}-N-metilmetanamina)	Ejemplo 8 (Página 65)  <chem>CN(C)Cc1cc2c(cc1n2)nc3cc(ccc3S(=O)(=O)c4cc(F)c(F)cc4)c5ccccc5</chem> 1-({1-[(2,6-difluorophenyl)sulfonyl]-2-phenyl-1H-imidazol-4-yl}-N-methylmethanamine)
Compuesto de la Reivindicación 7  <chem>CN(C)Cc1cc2c(cc1n2)nc3cc(F)ccn3</chem> 1-({1-[(2-fluorophenyl)-3-yl]-5-[(4-methoxyphenyl)sulfonyl]-1H-pirazol-3-il}-N-metilmetanamina)	Ejemplo 7 (Página 65)  <chem>CN(C)Cc1cc2c(cc1n2)nc3cc(ccc3S(=O)(=O)c4cc(OC)ccc4)c5ccccc5</chem> 1-({1-[(3-methoxyphenyl)sulfonyl]-2-phenyl-1H-imidazol-4-yl}-N-methylmethanamine)
Compuesto de la Reivindicación 8  <chem>CN(C)Cc1cc2c(cc1n2)nc3cc(F)ccn3</chem> 1-({1-[(2-fluoropyridin-3-il)-5-[(3-metilfenil)sulfonyl]-1H-pirazol-3-il}-N-metilmetanamina)	Ejemplo 11 (Página 67)  <chem>CN(C)Cc1cc2c(cc1n2)nc3cc(ccc3S(=O)(=O)c4ccc(C)cc4)c5ccccc5</chem> N-methyl-1-({1-[(4-methylphenyl)sulfonyl]-5-phenyl-1H-pyrazol-3-yl}methanamine)
Compuesto de la Reivindicación 9  <chem>CN(C)Cc1cc2c(cc1n2)nc3cc(F)ccn3</chem> 3-({1-[(2-fluoropyridin-3-il)-3-[(metilamino)metil]-1H-pirazol-5-il)sulfonyl}benzonitrilo)	Ejemplo 10 (Página 66)  <chem>CN(C)Cc1cc2c(cc1n2)nc3cc(ccc3S(=O)(=O)c4ccccc4)c5ccccc5</chem> N-methyl-1-({1-phenyl-2-(phenylsulfonyl)-1H-imidazol-4-yl}methanamine)

El Estado de la Técnica D1 se considera el más cercano a la invención, porque divulgan compuestos específicos derivados de fenilsulfonyl imidazol/pirazol con actividad inhibidora de bomba de protones Na^+/H^+ ATP asa, para el tratamiento de enfermedades relacionadas con el incremento de producción de ácido estomacal (D1: Páginas 65 a 67, ejemplos 7, 8, 10 y 11).

La diferencia entre los compuestos específicos de la invención y los ejemplos ilustrados en D1, consisten en que para la invención el anillo central es un pirazol sustituido en posición 1 por un 2 – fluoropiridin – 3 – il y sustituido en posición 5 por un fenilsulfonyl sustituido, mientras que en D1 el anillo central es preferiblemente un imidazol sustituido en posición 1 por un fenilsulfonyl sustituido y en posición 2 por un fenil.

Esta diferencia no parece conceder ningún efecto técnico inesperado o ventajoso a los compuestos de la invención con respecto a lo divulgado en D1, al comparar la actividad de los compuestos divulgados en la invención con los compuestos de D1, se observa que los compuestos de D1 poseen una mejor actividad IC_{50} para inhibir la bomba de protones, particularmente para el Ejemplo 7, el cual se cita

dentro de este análisis (Ver en esta Solicitud la Tabla 1 en el folio 100 y ver en D1 la tabla 1 en la página 69, párrafo [0263]).

Compuestos de la Invención		Compuestos de D1	
Ejemplo	IC ₅₀ (nM)	Ejemplo	IC ₅₀ (nM)*
1	120	1	180
2	350	5	160
3	88	7	30
4	230	12	170

* En la tabla original se reporta la actividad como IC₅₀ (µM) y se realiza la respectiva conversión a IC₅₀ (nM)

El Problema Técnico Objetivo que se pretende resolver es el siguiente: ¿Cómo modificar los compuestos divulgados en D1 para obtener compuestos específicos derivados de 1 – (2 – fluoropiridin – 3 – il) – 5 – fenilsulfonil pirazol, inhibidores de la bomba de protones Na⁺/H⁺ ATP asa útiles en el tratamiento de ulcera péptica y de enfermedades relacionadas con la sobreproducción de acido en el estómago?

D1 divulga en la página 20 una estructura de la fórmula la – 16, donde se observa un compuesto derivado de pirazol, el cual se sustituye en posición 1 por el sustituyente R^{2a} (el cual puede ser un fenil sustituido por halógeno o un piridin sustituido por halógeno), también se sustituye en posición 5 por el sustituyente -SO₂ – R^{1a} (Donde R^{1a} puede ser un fenil sustituido por halógeno, CN, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ alcoxi),en posición 3 se encuentra el sustituyente R^{3a} que es un CH₂NHCH₃ y en posición 4 de este anillo de pirazol se encuentra el sustituyente R^{6a} que es H (Ver en D1: Página 30, líneas 40 – 44 y 49 – 53; página 31, líneas 25, 29, 32 y 33; página 32, líneas 13 y 16 – 18).

Por lo tanto, una persona versada en la materia y conocedora de los conceptos divulgados en D1, lograría sin ningún esfuerzo y a partir de la fórmula la – 16 sugerida en D1, cambiar el anillo central de imidazol por el anillo de pirazol de esta fórmula y de acuerdo a los sustituyentes planteados en esta fórmula, permutar el fenil por un 2 – fluoropiridin – 3 – il en la posición 1 del pirazol y así mismo introducir sustituyentes tales como alquilo, alcoxi, CN o halógenos al fenilsulfonil de la posición 5 del anillo de pirazol, tal cual lo sugiere D1, para obtener de esta forma los compuestos propuestos en esta invención de manera obvia o evidente.

En consecuencia, la reivindicaciones 6 a 9, de acuerdo a lo divulgado en D1, carecen de Nivel Inventivo.

Las reivindicaciones 1 a 5, de las cuales dependen dichas reivindicaciones, así como las reivindicaciones 10 y 11, dependientes de las reivindicaciones 6 a 9, no divulgan características inventivas adicionales para los compuestos específicos de estas reivindicaciones. Por lo tanto, estas reivindicaciones también carecen de Nivel Inventivo.

8. Conclusión

Los requisitos de Patentabilidad de esta solicitud se ven afectados de la siguiente manera:

Item	Documento	Reivindicaciones	Requisitos que afecta
D1	EP2005957	1 a 11	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 2013-02-05

Elaboró: Dayron Alexander Ramirez Reyes
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Roza