

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 11-177476- -4	FECHA: 2013-04-25 17:18:43
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)
LUZ CLEMENCIA DE PAEZ

Asunto: Radicación: 11-177476- -4
 Trámite: 11
 Evento: 378
 Actuación: 519
 Oficio: 7618
 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	US2010/39731				
Fecha de Presentación Internacional	24/06/2010				

1 . Documentos estudiados:

Descripción: Radicado N° 11-177476-00000-0000 23/12/2011

Reivindicaciones: Radicado N° 11-177476-00000-0000 23/12/2011

Prioridad: US 61/220.683 26/06/2009
 FR 0959110 17/12/2009

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.

Teniendo en cuenta que el solicitante pagó la tasa correspondiente a las reivindicaciones adicionales, se procederá a estudiar el capítulo reivindicatorio presentado.

Título de la solicitud: "NUEVAS SALES DE FUMARATO DE UN ANTAGONISTA DEL RECEPTOR DE HISTAMINA H3".

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de sales de un derivado de sulfonamida con mejor procesabilidad, solubilidad o vida útil en depósito, mejor biodisponibilidad, menos reacciones adversas en el tubo digestivo y mejor administración del fármaco al sitio diana objetivo.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona sales fumarato de 2-(ciclohexilmetil)-N-{2-[(2S)-1-metilpirrolidin-2-il]etil}-1,2,3,4-tetrahidroisoquinolina-7-sulfonamida.

El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 401/012.

4. Excepciones de patentabilidad (Art 20 D486 literal a)-d))

El objeto de la reivindicación 16 no es patentable de acuerdo con el Art citado.

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

El uso de la reivindicación 15 no es patentable, de acuerdo con el Art 14.

6. De la solicitud de patente

Título

El título de la solicitud debe especificar el compuesto base del cual se reclaman sus sales fumarato y no hacer mención de la actividad de dicho compuesto, por lo cual se sugiere al solicitante hacer la corrección necesaria.

7. Análisis de la(s) oposición(es)

No se presentaron oposiciones al objeto reivindicado.

8. 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: 26 de junio de 2009 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	US2007/0105834	"Tetrahydroisoquinoline sulfonamide derivatives, the preparation thereof, and the use of the same in therapeutics"	10/Mayo/2007
D2	Journal of Pharmaceutical Sciences 66, N° 1, pp 2 a 19	"Pharmaceutical salts"	Enero/1977

El documento D1^[1] divulga el compuesto 2-(ciclohexilmetil)-N-{2-[(2S)-1-metilpirrolidin-2-il]etil}-

[1] URL: <http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?>

CC=US&NR=2007105834A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20070510&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP

1,2,3,4-tetrahidroisoquinolina-7-sulfonamida y sus sales farmacéuticamente aceptables (Párrafos 0027 y 0028) y oxalatos (Ejs. 2-4).

El documento D2^[2] divulga los efectos químicos, biológicos y físicos que pueden obtenerse al obtener las sales de un compuesto farmacéutico (Págs. 1-17).

9 . Examen de patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel inventivo (Art 18 D486)

La reivindicación 1 consiste en: Un compuesto seleccionado del grupo que consiste en: Monohidrato de difumarato de 2-(ciclohexilmetil)-N-{2-[(2S)-1-metilpirrolidin-2-il]etil}-1,2,3,4-tetrahidroisoquinolina-7-sulfonamida... (Pág. 42 Radicado N° 11-177476-00000-0000).

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

Características esenciales	D1	D2
2-(ciclohexilmetil)-N-{2-[(2S)-1-metilpirrolidin-2-il]etil}-1,2,3,4-tetrahidroisoquinolina-7-sulfonamida	2-(ciclohexilmetil)-N-{2-[(2S)-1-metilpirrolidin-2-il]etil}-1,2,3,4-tetrahidroisoquinolina-7-sulfonamida	No menciona
Sales de fumarato: monohidrato de difumarato, difumarato, hemifumarato, dihidrato de hemifumarato	Sales farmacéuticamente aceptables: P. Ej. succinato	La formación de sales es una reacción ácido-base que implica una transferencia de protones o una reacción de neutralización y es por lo tanto controlada por factores que influyen en tales reacciones. (Pág. 003, col. izquierda). La tabla I categoriza todas las formas de sal aprobadas por la FDA, entre las que se encuentran las de fumarato.
Forma cristalina	Forma cristalina	Procesos para la obtención de sales y sus formas cristalinas de un compuesto sólido. (Pág. 002).

Los documentos D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulgan el compuesto y sus sales. El documento D1 menciona el compuesto 2-(ciclohexilmetil)-N-{2-[(2S)-1-metilpirrolidin-2-il]etil}-1,2,3,4-tetrahidroisoquinolina-7-sulfonamida y que puede estar en forma de sales derivadas de ácidos inorgánicos y orgánicos que permitan una separación o cristalización adecuada del compuesto (Párrafo 0027). Estas sales se preparan según los métodos convencionales conocidos por la persona versada en la materia, empleando un solvente apropiado y separación mediante evaporación del solvente o filtración (Párrafo 0027). Estos compuestos pueden también existir en forma de hidratos o solvatos (Párrafo 0028).

De otro lado, el documento D2 enseña que la formación de sales consiste en una reacción ácido-base con transferencia de un protón, o puede ser una reacción de neutralización y en teoría todo compuesto que exhiba características ácias o básicas puede formar una sal (Pág. 3).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1, y el compuesto del documento D1 consiste en que no se especifican sus sales fumarato.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1, y las enseñanzas del documento D2 consiste en que dicha anterioridad no especifica el compuesto base de la presente solicitud.

[2] URL: <http://onlinelibrary.wiley.com/doi/10.1002/jps.2600660104/abstract>

El efecto que confiere la diferencia es que se logran sales de fumarato que mejoran las características físico-químicas del compuesto base, aunque esto no se puede determinar ya que la solicitud carece de información que permita establecer alguna ventaja inesperada.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo modificar el compuesto 2-(ciclohexilmetil)-N-{2-[(2S)-1-metilpirrolidin-2-il]etil}-1,2,3,4-tetrahidroisoquinolina-7-sulfonamida conocido en el documento D1 para lograr una alternativa y que conserve el efecto como antagonista del receptor de histamina H3”.

Sin embargo, la utilización de diferentes solventes y condiciones para lograr una sal que mejore las condiciones de solubilidad y otros parámetros físicoquímicos, ya está divulgada en el documento D2 que enseña que la forma salina de un fármaco imparte mejoras en la solubilidad en agua, puede ser menos tóxica o disminuir la velocidad de disolución, lo cual s de gran utilidad en la preformulación (Pág. 3, Col. derecha). De otro lado, la solicitud carece de información que permita establecer que las sales obtenidas sean inesperadamente ventajosas en relación con el compuesto del documento D1.

En consecuencia, era obvio para la persona del oficio normalmente versada en la materia referirse a las enseñanzas divulgadas en el documento D2 con el fin de mejorar o aumentar la biodisponibilidad y parámetros físico-químicos del fármaco descrito en el documento D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud.

En ausencia de un efecto inesperado mostrado por las sales fumarato reivindicadas en relación con las sales del arte anterior, la solución al problema técnico parece ser obvia a la luz de los documentos D1 y D2.

Conclusión:
La reivindicación 1 no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18). Las reivindicaciones dependientes 5, 6, 10 a 13 y las independientes 2 a 4, 7 a 9 y 14 no mencionan alguna característica adicional que haga inventivo el objeto reclamado, por lo tanto, también carecen de nivel inventivo.

10. Conclusión:

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	US2007/0105834	1 a 14	Nivel inventivo
D2	Journal of Pharmaceutical Sciences 66, N° 1, pp 2 a 19	1 a 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 2013-04-30

Elaboró: Lina Patricia Forero Tobaría
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Roza