

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO			
RAD: 12-144291- -4	FECHA: 2014-05-09 18:09:32		
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I		
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 8		
ACT: 519 PRESENTACION			

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

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

Asunto: Radicación: 12-144291- -4
 Trámite: 11
 Evento: 378
 Actuación: 519
 Oficio: 5626
 Folios: 8

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/EP/052512				
Fecha de Presentación Internacional	21/02/2011				

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:	Radicado 12-144291-00000-0000	24/Agosto/2012
Reivindicaciones:	Radicado 12-144291-00000-0000	24/Agosto/2012
Dibujos:	Radicado 12-144291-00000-0000	24/Agosto/2012
Prioridad:	EP2010/052232	23/Febrero/2010

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.

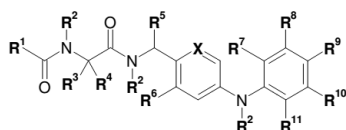
3. Objeto de la invención

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. Para el presente caso se requiere a la solicitante allegar el comprobante de pago correspondiente a las reivindicaciones adicionales. Con relación a la presente solicitud se estudiarán las reivindicaciones 1 a 28 de acuerdo al radicado 12-144291-00000-0000.

Título de la solicitud: "Compuestos en calidad de antagonistas de bradiquinina-B1"

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar compuestos derivados de 3-oxo-piridazina con mejorada actividad antagónica bradiquinina-1 (B1) para el tratamiento y prevención del dolor.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de fórmula general (I) y composiciones que lo comprenden caracterizado por:



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 211/62, 213/81, 233/90, 239/28, 261/18, 271/10, 239/557, 207/277, 401/12, 405/12; C07C 237/14; A61K 31/165, 31/44, 31/505, 31/506.

4. De la solicitud de patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

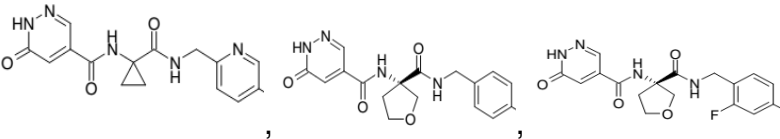
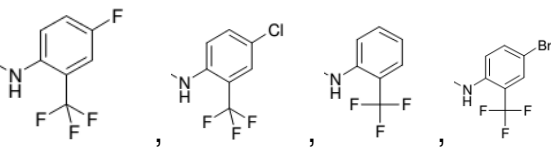
La reivindicación 14 no es clara porque el término "eventualmente" es impreciso, por lo cual no permite distinguir la invención del estado de la técnica. Se sugiere sustituirlo por un término concreto.

Las reivindicaciones 15-17 no son claras porque indican el uso que puede darse al producto reivindicado, el cual no es una característica técnica que defina a la invención. Se sugiere eliminar dicha cláusula.

La reivindicación 18 no es clara porque reclama un procedimiento pero define las etapas u operaciones unitarias que lo definen, indicando condiciones el procedimiento, ingredientes y proporciones. Además, no sustenta la vía no química incluida como característica en la cláusula. Se sugiere definir las etapas del procedimiento y eliminar la expresión "vía no química" por falta de sustento.

Las reivindicaciones 1-2 no son concisas porque las definiciones de R1, R2, R3, R4, R5, R6, R7, R8, R9, R10 y R11 son generales, se sugiere restringir la solicitud a los sustituyentes que han sido probados, es decir, que se encuentran debidamente sustentados, de acuerdo a lo presentado en la tabla No 1.

Tabla 1. Sustituyentes probados

Radical	Sustituyentes probados
R1-R2-R3-R4-R5-R6	
R2-R7-R8-R9-R10-R11	

Las reivindicaciones 13-14 y 18 no son concisas porque las definiciones de sales farmacéuticamente aceptables, ácidos o bases inorgánicas u orgánicas, sustancias de soporte y/o agentes diluyentes inertes son generales, se sugiere restringir la solicitud a los ácidos y bases e ingredientes no activos que han sido probados, es decir, que se encuentran debidamente sustentados, de acuerdo a lo presentado en la tabla No 2.

Tabla No 2.

Sustancias	Ejemplos sustentados
Ácidos y bases para formar sales farmacéuticamente aceptables	No define ejemplos concretos de ácidos o bases para formar sales farmacéuticamente aceptables del compuesto reclamado
Agentes de soporte y/o diluyentes inertes	Manitol, agua, lactosa, almidón de maíz, polivinilpirrolidona, estearato de magnesio, polietilenglicol y monoestearato de polietilensorbitán

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 la cual se invoca prioridad, es decir, febrero 23 de 2010. 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	WO2003066577	"N-biphenylmethyl aminocycloalkanecarboxamide derivatives with a substituent on the methyl useful as bradykinin antagonists"	14/Agosto/2003
D2	WO2008050167	"New Phenylsulfamoyl benzamide derivatives as bradykinin antagonists"	02/Mayo/2008
D3	WO2004019868	N-Biaryl methyl aminocycloalkanecarboxamide derivatives"	11/Mayo/2004

El documento D1⁽¹⁾ divulga compuestos derivados de N-bifenilmetil-aminocicloalquilcarboxamida con actividad antagonista de bradiquinina-1, útiles en el tratamiento del dolor e inflamación asociados a la ruta bradiquinina-1 (Resumen).

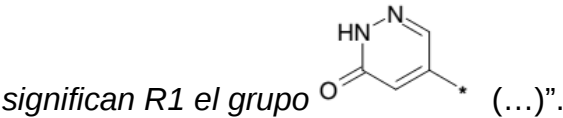
El documento D2 ⁽²⁾ divulga derivados de sulfonamida usados en el tratamiento del dolor y la inflamación que actúan seleccionando e inhibiendo los receptores bradiquinina (Resumen y Pág. 3, Líneas 15-19).

El documento D3⁽³⁾ divulga compuestos derivados de N-biarilmetil aminocicloalcanocarboxamidas útiles en el tratamiento de dolor y la inflamación mediante la inhibición de la bradiquinina (Resumen).

6. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel inventivo (Art18 D486)

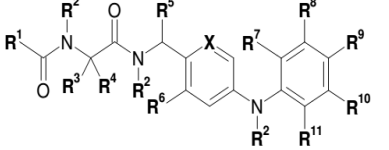
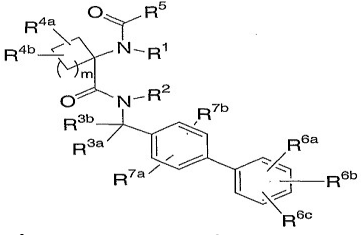
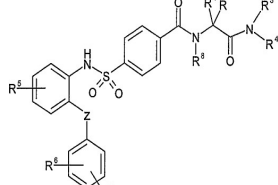
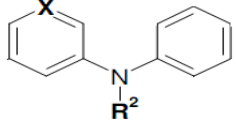
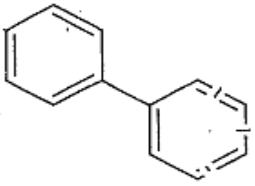
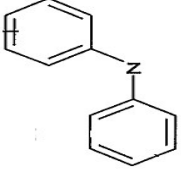
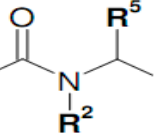
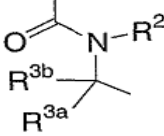
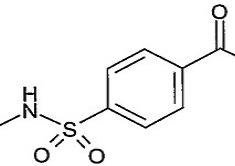
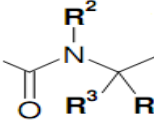
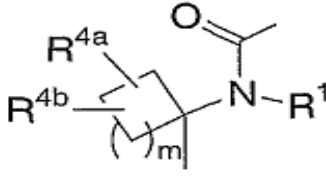
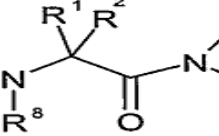
La reivindicación 1 consiste en "Compuestos de fórmula general (I) en el cual

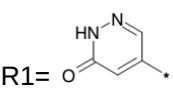
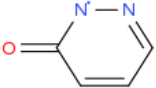


Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D1	D2
Compuesto de fórmula general (I)	Compuesto de fórmula (I)	Compuesto de fórmula (I)

1. <https://www.google.com/patents/WO2003066577A1?cl=en&dq=WO2003066577&hl=es&sa=X&ei=ZsFKU5CkO8awsATh2ICQDg&ved=0CDgQ6AEwAA>
2. https://www.google.com/patents/WO2008050167A1?cl=en&dq=N-phenylaniline+and+BRADYKININ&hl=es&sa=X&ei=SBRTU7OXEumxsQT_jYCIDQ&ved=0CGUQ6AEwBTge
3.

	 (Págs. 69-72, Rv. 1)	 (Págs. 79-80, Rv. 1)
 donde X=Carbono R2=Hidrógeno o metilo	 (Págs. 69-72, Rv. 1)	 donde Z=NRc y Rc=Hidrógeno o alquilo C1-C4 (Págs. 79-80, Rv. 1)
R6=Hidrógeno, F, Cl, Alquilo	R7a=Hidrógeno, Halógeno, Alquilo C1-C4 R7b= Hidrógeno (Págs. 69-72, Rv. 1)	R5=Hidrógeno, Halógeno, alquilo C1-C4 (Págs. 79-80, Rv. 1)
R7=H, F, Cl, Br, -CN, alquilo C1-C4 R8=Hidrógeno R9=F, Cl, Br, Alquilo C1-C4, -O-alquilo C1-C4 y -S-alquilo C1-C4 R10=Hidrógeno R11=F, Cl, Br, -CN, alquilo C1-C4, CH₃F, CH₂F₂	R6a=Halógeno, ciano y alquilo C1-C8 R6b=Halógeno, alquilo C1-C8, -O-Ra(Ra=alquilo C1-C4) y S(O)_kRd (k=0, Rd=alquilo C1-C4) R6c=Halógeno, ciano, alquilo C1-C8 sustituido por halógeno 1-5) (Págs. 69-72, Rv. 1)	R6= Hidrógeno, halógeno, ciano, trifluorometil, alcoxi C1-C4, alquilo C1-C4 R7=Hidrógeno, halógeno, ciano, trifluorometil, alcoxi C1-C4, alquilo C1-C4 (Págs. 79-80, Rv. 1)
 donde R2=Metilo y Hidrógeno R5=Hidrógeno	 donde, R2=Hidrógeno y alquilo R3a=Hidrógeno R3b=Alquilo C1-C4 (Págs. 69-72, Rv. 1)	 (Págs. 79-80, Rv. 1)
 donde R2=H, metilo R3 y R4 juntos con el carbono al que están unidos forman un cicloalquileo C3-C6	 donde R1=Hidrógeno, alquilo C1-C4 R4a y R4b son hidrógeno m=0,1 (Págs. 69-72, Rv. 1)	 R1 y R2 juntos al carbono adyacente forman un cicloalcano de 3-7 miembros (Págs. 79-80, Rv. 1)

 R1=	R5=  (Págs. 69-72, Rv. 1)	R3=Alquil C1-C8- imidazol R4=Hidrógeno (Págs. 79-80, Rv. 1)
--	--	--

Los documentos D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque en el caso del documento D1 divulga compuestos derivados de N-bifenilmetil-aminocicloalquilcarboxamida con actividad antagonista de bradiquinina-1, útiles en el tratamiento del dolor e inflamación asociados a la ruta bradiquinina-1 y que dichos compuestos presentan una amida unida al oxo-piridazin (Resumen y Págs. 69-72, Rv. 1). Por su parte, el documento D2 divulga derivados de sulfonamida usados en el tratamiento del dolor y la inflamación que actúan seleccionando e inhibiendo los receptores bradiquinina (Resumen y Pág. 3, Líneas 15-19).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto divulgado en el documento D1 consiste en que el compuesto reclamado incluye entre los dos anillos de fenilo una amina, mientras que el compuesto revelado en el documento D1 presenta directamente unidos los anillos de fenilo.

El efecto que logra el incluir una amina entre los dos anillos en el compuesto de fórmula (I) consiste en que se aumenta la actividad antagonista bradiquinina B-1.

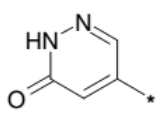
Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo proporcionar un compuesto alternativo con una mejora actividad analgésica”.

Sin embargo, la inclusión de una amida entre los dos anillos en compuestos con actividad antagonista bradiquinina-1, está divulgada en el documento D2 que enseña compuestos con actividad antagonista de bradiquinina útiles en el tratamiento del dolor e inflamación, que incluyen entre los dos anillos de fenilo una amina (Resumen y Págs. 79-80, Rv. 1).

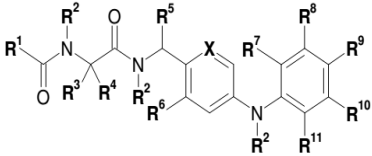
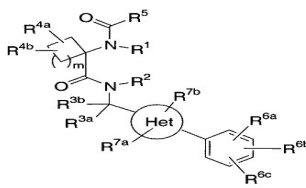
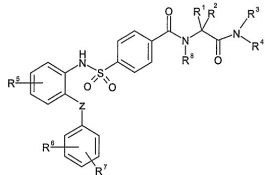
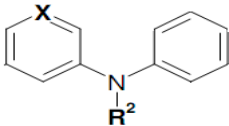
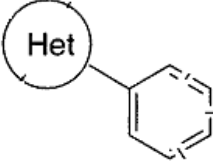
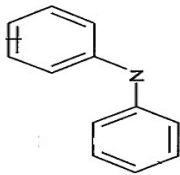
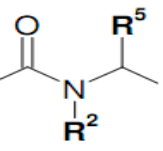
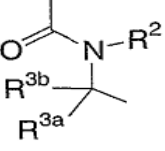
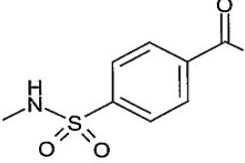
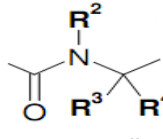
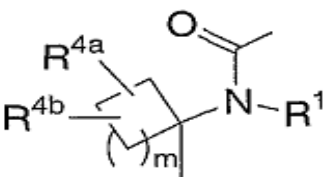
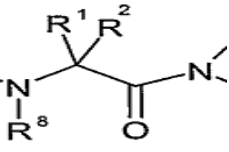
En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría la amina entre los dos fenilos de acuerdo con lo divulgado en el documento D2 dentro de la estructura del compuesto revelado en el documento D1, para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

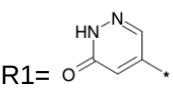
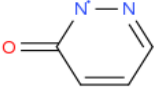
Puesto que las reivindicaciones dependientes 2-18 no mencionan características inventivas adicionales acerca del compuesto reclamado, tampoco se pueden considerar inventivas.

La reivindicación 1 consiste en “Compuestos de fórmula general (I) en el cual

significan R1 el grupo  (...).”

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

Características esenciales	D3	D2
Compuesto de fórmula general (I) 	Compuesto de fórmula (I)  (Págs. 52-54, Rv. 1)	Compuesto de fórmula (I)  (Págs. 79-80, Rv. 1)
 donde X=Nitrógeno R2=Hidrógeno o metilo	 Donde Het=Piridina (Págs. 52-54, Rv. 1)	 donde Z=NRc y Rc=Hidrógeno o alquilo C1-C4 (Págs. 79-80, Rv. 1)
R6=Hidrógeno, F, Cl, Alquilo	R7a=Hidrógeno, Halógeno, Alquilo C1-C4 R7b= Hidrógeno (Págs. 52-54, Rv. 1)	R5=Hidrógeno, Halógeno, alquilo C1-C4 (Págs. 79-80, Rv. 1)
R7=H, F, Cl, Br, -CN, alquilo C1-C4 R8=Hidrógeno R9=F, Cl, Br, Alquilo C1-C4, -O-alquilo C1-C4 y -S-alquilo C1-C4 R10=Hidrógeno R11=F, Cl, Br, -CN, alquilo C1-C4, CH3F, CH2F2	R6a=Halógeno, ciano y alquilo C1-C8 R6b=Halógeno, alquilo C1-C8, -O-Ra(Ra=alquilo C1-C4) y S(O)kRd (k=0, Rd=alquilo C1-C4) R6c=Halógeno, ciano, alquilo C1-C8 sustituido por halógeno 1-5) (Págs. 52-54, Rv. 1)	R6= Hidrógeno, halógeno, ciano, trifluorometil, alcoxi C1-C4, alquilo C1-C4 R7=Hidrógeno, halógeno, ciano, trifluorometil, alcoxi C1-C4, alquilo C1-C4 (Págs. 79-80, Rv. 1)
 donde R2=Metilo y Hidrógeno R5=Hidrógeno	 donde, R2=Hidrógeno y alquilo R3a=Hidrógeno R3b=Alquilo C1-C4 (Págs. 52-54, Rv. 1)	 (Págs. 79-80, Rv. 1)
 donde R2=H, metilo R3 y R4 juntos con el carbono al que están unidos forman un cicloalquileo C3-C6	 donde R1=Hidrógeno, alquilo C1-C4	 R1 y R2 juntos al carbono adyacente

	R4a y R4b son hidrógeno m=0,1 (Págs. 52-54, Rv. 1)	forman un cicloalcano de 3-7 miembros (Págs. 79-80, Rv. 1)
R1= 	R5=  (Págs. 52-54, Rv. 1)	R3=Alquil C1-C8- imidazol R4=Hidrógeno (Págs. 79-80, Rv. 1)

Los documentos D3 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque en el caso del documento D3 divulga compuestos derivados de N-biarilmetil aminocicloalcanocarboxamidas útiles en el tratamiento de dolor y la inflamación mediante la inhibición de la bradiquinina (Resumen). Por su parte, el documento D2 divulga derivados de sulfonamida usados en el tratamiento del dolor y la inflamación que actúan seleccionado e inhibiendo los receptores bradiquinina (Resumen y Pág. 3, Líneas 15-19).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto divulgado en el documento D3 consiste en que el compuesto reclamado incluye entre los dos anillos de fenilo una amina, mientras que el compuesto revelado en el documento D1 presenta directamente unidos los anillos de fenilo.

El efecto que logra el incluir una amina entre los dos arilos en el compuesto de fórmula (I) consiste en que se aumenta la actividad antagónica bradiquinina B-1.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo proporcionar un compuesto alternativo con una mejora actividad analgésica”.

Sin embargo, la inclusión de una amida entre los dos arilos en compuestos con actividad antagónica bradiquinina-1, está divulgada en el documento D2 que enseña compuestos con actividad antagónica de bradiquinina útiles en el tratamiento del dolor e inflamación, que incluyen entre los dos anillos de fenilo una amina (Resumen y Págs. 79-80, Rv. 1).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría la amina entre los dos fenilos de acuerdo con lo divulgado en el documento D2 dentro de la estructura del compuesto revelado en el documento D3, para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2-18 no mencionan características inventivas adicionales acerca del compuesto reclamado, 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	WO2003066577	1-18	Nivel Inventivo
D2	WO2001005783	1-18	Nivel Inventivo
D3	WO2004019868	1-18	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 del día siguiente 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 2014-05-13

Elaboró: German Antonio Clavijo Cohen

Revisó: Consuelo Leguizamon Leguizamon