

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO			
RAD: 13-19557- -6	FECHA: 2014-02-20 17:53:38		
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I		
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 11		
ACT: 519 PRESENTACION			

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

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

Asunto: Radicación: 13-19557- -6
 Trámite: 11
 Evento: 378
 Actuación: 519
 Oficio: 2151
 Folios: 11

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/EP2011/063286				
Fecha de Presentación Internacional	02/08/2011				

1. Documentos estudiados

Descripción:	Radicado N° 13-019557-00000-0000	01/02/2013
Reivindicaciones:	Radicado N° 13-019557-00000-0000	01/02/2013
Prioridad:	EP 10382215.1	03/08/2010

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.

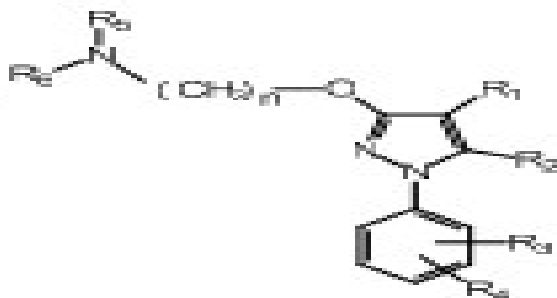
3. Objeto de la invención

De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del Capítulo Primero del Título 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.

Título de la solicitud: “USO DE LIGANDOS SIGMA EN LA HIPERALGESIA INDUCIDA POR OPIOIDES”

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar compuestos alternativos útiles para el tratamiento de hiperalgesia asociada a la terapia con opioides.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un ligando sigma que tiene la fórmula general (I)



(I)

El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K31/415 // 31/4155 // 31/5337; A61P23/00 // 29/00

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

El objeto de la reivindicación 12 no es patentable de acuerdo con el Art citado.

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

Las reivindicaciones 1 a 9, hacen referencia al uso de un ligando sigma. Se sugiere al solicitante eliminar esta expresión del capítulo reivindicatorio y definir desde la reivindicación principal el compuesto de interés.

El uso de las reivindicaciones 10 y 11 no es patentable, de acuerdo con el Art 14.

6. De la Solicitud de Patente

Titulo

El título no corresponde con el objeto de la solicitud porque hace referencia a un uso lo cual no es patentable según la legislación aplicable. Adicionalmente no define las características técnicas esenciales de la fórmula Markush reclamada por lo cual se sugiere al solicitante hacer la corrección necesaria.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

El capítulo reivindicatorio no es conciso porque el único compuesto sustentado en los ejemplos de la descripción es el 4-{2-[5-metil-1-(naftalen-2-il)-1H-pirazol-3-iloxi]etil}morfolina en el cual R¹ corresponde a un átomo de hidrógeno, R² corresponde a un sustituyente metilo, los sustituyentes R³ y R⁴ junto con el anillo de fenilo al cual se unen forman un anillo de naftaleno, R⁵ y R⁶ junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen forman un anillo de morfolino y n es igual a 2. Por lo tanto se sugiere a la solicitante restringirse a los compuestos sustentados en la descripción.

La reivindicación 1 indica el uso que puede darse al ligando sigma aunque la reivindicación esté encabezada en términos de “Ligando sigma”. Se sugiere eliminar esta reivindicación del pliego reivindicatorio.

La reivindicación 2 no es clara ni concisa cuando utiliza los términos “antagonista del receptor sigma”, “antagonista neutro”, “agonista parcial” y “antagonista parcial” los cuales corresponden a

definiciones genéricas y funcionales y no definen un compuesto como tal. Se sugiere restringirse a los compuestos sustentados en la descripción.

La reivindicación 11 no es clara ni concisa cuando reclama una combinación de al menos un ligando sigma según cualquier reivindicación anterior y al menos un compuesto opioide u opiáceo. Esta manera de reclamar dichos componentes no es válida puesto que no define un componente como tal. Además se encuentra el término “al menos” el cual no es limitativo ni preciso. Adicionalmente indica el uso que puede darse a la combinación aunque la reivindicación esté encabezada en términos de “Combinación”. Se sugiere eliminar esta reivindicación del pliego reivindicatorio.

La reivindicación 12 se refiere a un método de tratamiento el cual no es patentable según la legislación aplicable (Art 20 D 486 literal (d))

7. 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 03 de agosto de 2010.
Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontró (encontraron) el (los) siguiente(s) documento(s) que anticipa(n) el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1 ^[1]	EP2113501	“5-METHYL-1-(NAPHTHALEN-2-YL)-1H-PYRAZOLES USEFUL AS SIGMA RECEPTOR INHIBITORS”	04/Noviembre/2009
D2 ^[2]	EP2116539	“1-ARYL-3-AMINOALKOXY-PYRAZOLES AS SIGMA LIGANDS ENHANCING ANALGESIC EFFECTS OF OPIOIDS AND ATTENUATING THE DEPENDENCY THEREOF”	11/Noviembre/2009
D3 ^[3]	WO2006021462	“SIGMA RECEPTOR INHIBITORS”	02/Marzo/2006
D4 ^[4]	WO2007098953	“PYRAZOLE DERIVATIVES AS SIGMA RECEPTOR INHIBITORS”	07/Septiembre/2007
D5 ^[5]	WO2009130310	“1-ARYL-3-AMINOALKOXY PYRAZOLES AS SIGMA LIGANDS ENHANCING ANALGESIC EFFECT OF OPIOIDS AND ATTENUATING THE DEPENDENCY THEREOF”	29/Octubre/2009
D6	Libro	“Handbook of Pharmaceutical Analysis”	2002

El documento D1 divulga un compuesto derivado de pirazol de la fórmula (I) (Pág. 3, líneas 1 – 31)

El documento D2 divulga un compuesto 1- aril, 3-aminoalcoxi pirazol de la fórmula (I) (Pág. 4, líneas 1 – 44)

El documento D3 divulga un compuesto derivado de pirazol de la fórmula (I) (Pág. 5. línea 1 a Pág. 6. línea 20)

El documento D4 divulga un compuesto derivado de pirazol de la fórmula IB (Pág. 8. línea 10 a Pág. 11. línea 31)

El documento D5 divulga un compuesto 1- aril, 3-aminoalcoxi pirazol de la fórmula (I) (Pág. 3. línea 6 a Pág. 4. línea 28)

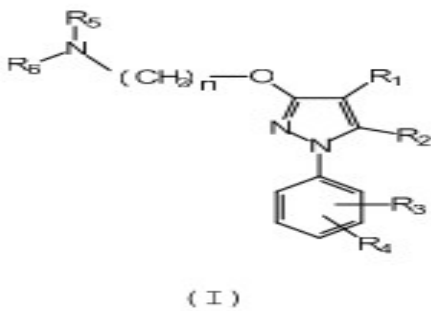
1[]URL:http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=EP&NR=2113501A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20091104&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP
2[]URL:http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=EP&NR=2116539A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20091111&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP
3[]URL:http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2006021462A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20060302&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP
4[]URL:http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2007098953A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20070907&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP
5[]URL:http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2009130310A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20091029&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP

El documento D6 divulga el uso de las sales clorhidrato en la preparación de compuestos farmacéuticos (Chapter 1 “Form selection of Pharmaceutical compounds”, III Salt Selection)

8 . Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

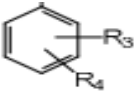
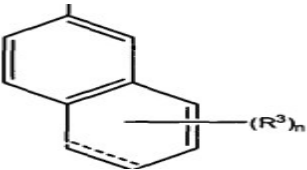
Novedad (Art 16 D486)

La reivindicación 3 consiste en un ligando sigma para su uso según cualquiera reivindicación anterior, que tiene la fórmula general (I)



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

Características esenciales	D1
(I)	(Pág. 3, líneas 1 – 31)
N(R5R6) (Ver reivindicación 3; radicado N° 13-019557-00000-0000)	N(R1R2) R1 es hidrógeno y R2 es hidroxietilo o R1 y R2 junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen forman un anillo de morfolino opcionalmente sustituido con uno o dos grupos hidroxilo. (Pág. 3. líneas 25 y 26)
-(CH2)n-O- n se selecciona de 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 y 8	-CH2-CH2-O
(Ver reivindicación 3; radicado N° 13-019557-00000-0000)	

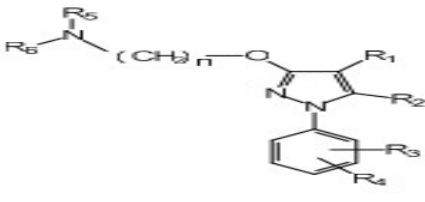
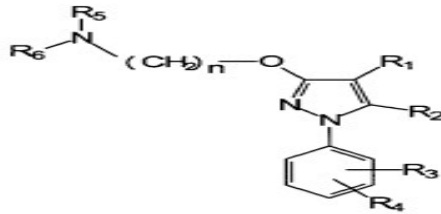
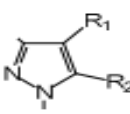
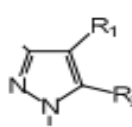
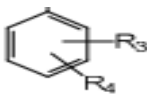
Características esenciales	D1
 (Ver reivindicación 3; radicado N° 13-019557-00000-0000)	 R³ es hidroxi o C₁₋₆ alcoxi (Pág. 3. línea 27)

Las características esenciales del compuesto de la reivindicación 3 habían sido divulgadas previamente en el documento D1, el cual da a conocer un compuesto derivado de pirazol de la fórmula (I) (Pág. 3, líneas 1 – 31)

En consecuencia, la reivindicación 3 no es nueva ó carece de novedad, según lo divulgado en el documento D1.

Puesto que las reivindicaciones 4 – 7 no mencionan características nuevas adicionales tampoco se pueden considerar nuevas.

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

Características esenciales	D2
 (I)	 (Pág. 4, líneas 1 – 44)
N(R₅R₆) (Ver reivindicación 3; radicado N° 13-019557-00000-0000)	N(R₅R₆)
-(CH₂)_n-O- n se selecciona de 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 y 8	-(CH₂)_n-O-
 (Ver reivindicación 3; radicado N° 13-019557-00000-0000)	
 (Ver reivindicación 3; radicado N° 13-019557-00000-0000)	

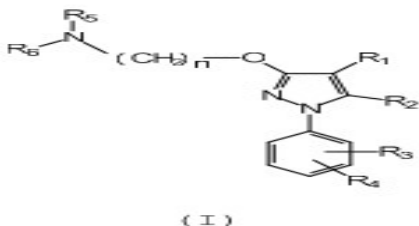
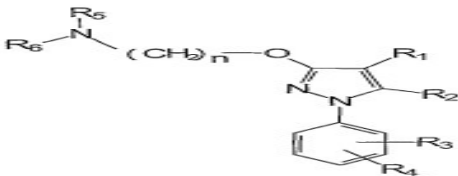
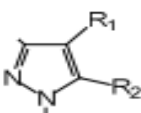
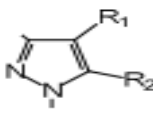
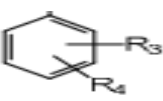
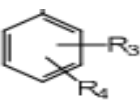
Características esenciales	D2
4-{2-[5-metil-1-(naftalen-2-il)-1H-pirazol-3-iloxi]etil}morfolina (Pág. 46, Ej.1 Compuesto 63)	4-{2-[5-metil-1-(naftalen-2-il)-1H-pirazol-3-iloxi]etil}morfolina (Reivindicación 9, Pág. 11, línea 44, compuesto 63)

Las características esenciales del compuesto de la reivindicación 3 habían sido divulgadas previamente en el documento D2, el cual da a conocer un compuesto 1- aril, 3-aminoalcoxi pirazol de la fórmula (I) (Pág. 4, líneas 1 – 44)

En consecuencia, la reivindicación 3 no es nueva ó carece de novedad, según lo divulgado en el documento D2.

Puesto que las reivindicaciones 4 – 9 no mencionan características nuevas adicionales tampoco se pueden considerar nuevas.

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

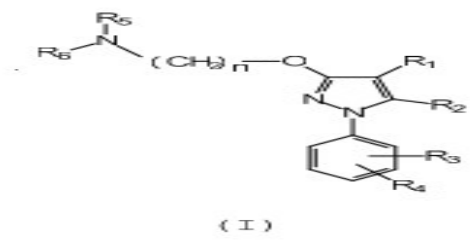
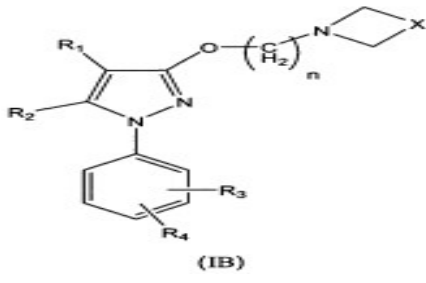
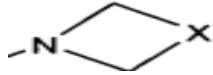
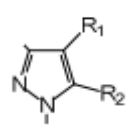
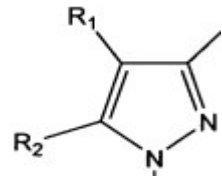
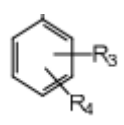
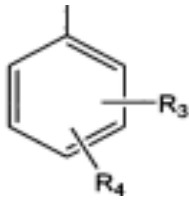
Características esenciales	D3
 (I)	 (Pág. 5. línea 1 a Pág. 6. línea 20)
N(R₅R₆) (Ver reivindicación 3; radicado N° 13-019557-00000-0000)	N(R₅R₆)
-(CH₂)_n-O- n se selecciona de 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 y 8	-(CH₂)_n-O-
 (Ver reivindicación 3; radicado N° 13-019557-00000-0000)	
 (Ver reivindicación 3; radicado N° 13-019557-00000-0000)	
4-{2-[5-metil-1-(naftalen-2-il)-1H-pirazol-3-iloxi]etil}morfolina (Pág. 46, Ej.1 Compuesto 63)	4-{2-[5-metil-1-(naftalen-2-il)-1H-pirazol-3-iloxi]etil}morfolina (Pág. 54, Ej. 61)

Las características esenciales del compuesto de la reivindicación 3 habían sido divulgadas previamente en el documento D3, el cual da a conocer un compuesto derivado de pirazol de la fórmula (I) (Pág. 5. línea 1 a Pág. 6. línea 20)

En consecuencia, la reivindicación 3 no es nueva ó carece de novedad, según lo divulgado en el documento D3.

Puesto que las reivindicaciones 4 – 9 no mencionan características nuevas adicionales tampoco se pueden considerar nuevas.

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

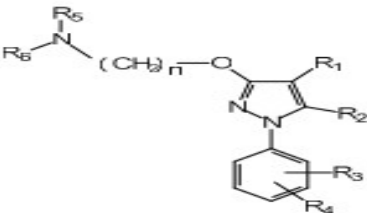
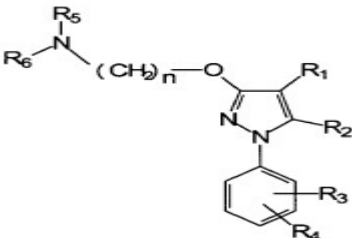
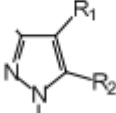
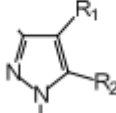
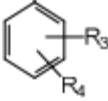
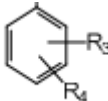
Características esenciales	D4
 (I)	 (IB) (Pág. 8. línea 10 a Pág. 11. línea 31)
N(R₅R₆) (Ver reivindicación 3; radicado N° 13-019557-00000-0000)	
-(CH₂)_n-O- n se selecciona de 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 y 8	-(CH₂)_n-O-
 (Ver reivindicación 3; radicado N° 13-019557-00000-0000)	
 (Ver reivindicación 3; radicado N° 13-019557-00000-0000)	

Las características esenciales del compuesto de la reivindicación 3 habían sido divulgadas previamente en el documento D4, el cual da a conocer un compuesto derivado de pirazol de la fórmula IB (Pág. 8. línea 10 a Pág. 11. línea 31)

En consecuencia, la reivindicación 3 no es nueva ó carece de novedad, según lo divulgado en el documento D4.

Puesto que las reivindicaciones 4 – 6 no mencionan características nuevas adicionales tampoco se pueden considerar nuevas.

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

Características esenciales	D5
 (I)	 (Pág. 3. línea 6 a Pág. 4. línea 28)
N(R₅R₆) (Ver reivindicación 3; radicado N° 13-019557-00000-0000)	N(R₅R₆)
-(CH₂)_n-O- n se selecciona de 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 y 8	-(CH₂)_n-O-
 (Ver reivindicación 3; radicado N° 13-019557-00000-0000)	
 (Ver reivindicación 3; radicado N° 13-019557-00000-0000)	
4-{2-[5-metil-1-(naftalen-2-il)-1H-pirazol-3-iloxi]etil}morfolina (Pág. 46, Ej.1 Compuesto 63)	4-{2-[5-metil-1-(naftalen-2-il)-1H-pirazol-3-iloxi]etil}morfolina (Pág. 11, línea 14, compuesto 63)

Las características esenciales del compuesto de la reivindicación 3 habían sido divulgadas previamente en el documento D5, el cual da a conocer un compuesto 1- aril, 3-aminoalcoxi pirazol de la fórmula (I) (Pág. 3. línea 6 a Pág. 4. línea 28)

En consecuencia, la reivindicación 3 no es nueva ó carece de novedad, según lo divulgado en el documento D5.

Puesto que las reivindicaciones 4 – 9 no mencionan características nuevas adicionales tampoco se pueden considerar nuevas.

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 10 consiste en un ligando sigma para su uso según la reivindicación 9, en el que el ligando sigma es clorhidrato de 4-{2-[5-metil-1-(naftalen-2-il)-1H-pirazol-3-iloxi]etil}morfolina

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

SOLICITUD	D2	D3	D5	D6
Clorhidrato de 4-{2-[5-metil-1-(naftalen-2-il)-1H-pirazol-3-iloxi]etil}morfolina	4-{2-[5-metil-1-(naftalen-2-il)-1H-pirazol-3-iloxi]etil}morfolina (Reivindicación 9, Pág. 11, línea 44, compuesto 63)	4-{2-[5-metil-1-(naftalen-2-il)-1H-pirazol-3-iloxi]etil}morfolina (Pág. 54, Ej. 61)	4-{2-[5-metil-1-(naftalen-2-il)-1H-pirazol-3-iloxi]etil}morfolina (Pág. 11, línea 14, compuesto 63)	Uso de clorhidratos en preparación de compuestos farmacéuticos

El documento D2 divulga un compuesto 1- aril, 3-aminoalcoxi pirazol de la fórmula (I) (Pág. 4, líneas 1 – 44) útil en tratamiento de hiperalgesia.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 10 y el compuesto del documento D2 consiste en que no divulga específicamente el clorhidrato del compuesto reclamado

El documento D3 divulga un compuesto derivado de pirazol de la fórmula (I) (Pág. 5. línea 1 a Pág. 6. línea 20) útil en tratamiento de hiperalgesia.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 10 y el compuesto del documento D3 consiste en que no divulga específicamente el clorhidrato del compuesto reclamado

El documento D5 divulga un compuesto 1- aril, 3-aminoalcoxi pirazol de la fórmula (I) (Pág. 3. línea 6 a Pág. 4. línea 28) útil en tratamiento de hiperalgesia.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 10 y el compuesto del documento D5 consiste en que no divulga específicamente el clorhidrato del compuesto reclamado

El documento D6 divulga el uso de las sales clorhidrato en la preparación de compuestos farmacéuticos (Chapter 1 “Form selection of Pharmaceutical compounds”, III Salt Selection)

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 10 y el compuesto del documento D5 consiste en que no divulga el compuesto 4-{2-[5-metil-1-(naftalen-2-il)-1H-pirazol-3-iloxi]etil}morfolina

El efecto que logra el incluir la sal clorhidrato del compuesto reclamado es que proporciona nuevos compuestos alternativos útiles para el tratamiento de hiperalgesia asociada a la terapia con opioides.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo modificar el compuesto conocido en los documentos D2, D3 y D5 para proporcionar nuevos compuestos alternativos útiles para el tratamiento de hiperalgesia asociada a la terapia con opioides”.

Sin embargo, la utilización de clorhidratos en preparación de compuestos farmacéuticos y su influencia en sus propiedades de estabilidad, solubilidad y biodisponibilidad entre otras, ya está divulgada en el documento D6 (Chapter 1 “Form selection of Pharmaceutical compounds”, III Salt Selection)

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, utilizaría una sal del compuesto reclamada; como lo sugieren los documentos D2, D3 y D5 que indican que el compuesto puede ser utilizado en forma de una sal, solvato o profarmaco farmacéuticamente aceptable y como se divulga en el documento D3 que indica la selección de sales en la preparación de compuestos farmacéuticos siendo la utilización de clorhidratos completamente conocida en el campo farmacéutico; para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia a la luz de los documentos D2 con D6, D3 con D6 y D5 con D6. Adicionalmente la solicitante no presenta evidencia del efecto técnico sorprendente presentado por el clorhidrato del compuesto reclamado con respecto al compuesto conocido en el estado de la técnica.

En conclusión la reivindicación 10 cumple el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

De igual manera se aclara a la solicitante que la combinación entre un ligando sigma y un agente opioide u opiáceo mencionada en la descripción y reclamada en la reivindicación 11 ya se encuentra divulgada en el estado de la técnica de la siguiente manera:

Documento D2 (Págs. 5 y 6, Párr. [0019])

Documento D5 (Pág. 8, línea 31 a Pág. 11, línea 18)

9. Conclusión

Los requisitos de Patentabilidad de la presente Solicitud están afectados así:

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	EP2113501	3 – 7	Novedad
D2	EP2116539	3 – 9	Novedad
		10	Nivel Inventivo
D3	WO2006021462	3 – 9	Novedad
		10	Nivel Inventivo
D4	WO2007098953	3 – 6	Novedad
D5	WO2009130310	3 – 9	Novedad
		10	Nivel Inventivo
D6	Handbook of Pharmaceutical Analysis	10	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 2014-02-25

Elaboró: Rodolfo Cadena Amaya
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Roza