

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES**

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
GERMÁN CASTILLO GRAU
(Apoderado)

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-007670- -00004-0000

Fecha: 2010-07-22 15:17:49 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 519 TRASLADOINFORME Folios: 1

ASUNTO	Radicación	07007670
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio	09257
	Folios	032

Patente de Invención ☒ Patente de Modelo de Utilidad ☐

Vía Nacional ☐

Vía PCT (fase nacional) ☒ Cap. I ☒ Cap. II ☐

No. Sol. Internacional PCT/US2005/023251

Fecha de Presentación Internacional 28-06-2005

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: 4 a 66) como se radicó inicialmente.

1.2. Reivindicaciones: 1 a 52 (Folios: 67 a 76) como se radicó inicialmente.

1.3. Prioridad: 28/06/2004 US 60/583901.

2. Análisis de la Prioridad:

La prioridad de la presente solicitud corresponde al objeto reivindicado.

3. Objeto de la invención:

La presente solicitud se titula: "Derivados fusionados de las pirimidinas y composiciones de los mismos como moduladores del receptor CXCR3, útiles para la prevención y el tratamiento de trastornos y enfermedades inflamatorias y de la inmunoregulación".

El objeto de la presente solicitud se refiere a moduladores del receptor CXCR3, composiciones que comprenden los compuestos y sus métodos de uso para el tratamiento de, por ejemplo, trastornos y enfermedades inflamatorias y de la inmunorregulación, incluidos asma y enfermedades alérgicas, así como patologías autoinmunes como artritis reumatoidea, esclerosis múltiple, enfermedad intestinal

inflamatoria, psoriasis y aterosclerosis.

Según la descripción, las quimiocinas pueden estimular la quimiotaxis, además inducir selectivamente otros cambios en las células que responden a ellas, incluidos cambios de forma, elevaciones transitorias de la concentración intracelular de iones libres de calcio, exocitosis de gránulos, regulación ascendente de las integrinas, formación de lípidos bioactivos y explosión respiratoria, asociada con la activación de los leucocitos. Entonces, las quimiocinas son desencadenantes precoces de la respuesta inflamatoria ya que causan la liberación de mediadores inflamatorios, quimiotaxis y extravasación a los lugares de infección o inflamación.

Existen cuatro clases de quimiocinas, CXC (α), CC (β), C (γ) y CX3C (δ). Los receptores de quimiocinas, como CCR1, CCR2, CCR2A, CCR2B, CCR3, CCR4, CCR5, CCR6, CCR7, CCR8, CCR9, CXCR1, CXCR2, CXCR3, CXCR4, CXCR5, CX3CR1 han sido implicados como importantes mediadores de trastornos y enfermedades inflamatorias y de la inmunorregulación, incluidos asma y enfermedades alérgicas, así como patologías autoinmunes como artritis reumatoidea y aterosclerosis. La altamente selectiva expresión de CXCR3 lo convierte en objetivo ideal para la intervención con miras a interrumpir el tráfico inadecuado de las células T. Las indicaciones clínicas de dicha intervención son las enfermedades autoinmunes mediadas por las células T como esclerosis múltiple, artritis reumatoidea y diabetes tipo 1. La inhibición del CXCR3 puede ser provechosa porque reduce el rechazo del trasplante de órganos.

En el capítulo reivindicatorio se reclama lo siguiente:

Reivindicaciones 1 a 44 (folios: 67 a 74): Un compuesto de fórmula (I) o una sal o profármaco farmacéuticamente aceptables del mismo.

Reivindicación 45 (folios: 74 y 75): Una composición farmacéutica que comprende el compuesto de la reivindicación 1 o la reivindicación 21 y un vehículo, diluyente o excipiente farmacéuticamente aceptable.

Reivindicaciones 46 a 52 (folios: 75 y 76): Un método para tratar una afección o enfermedad inflamatoria o inmunitaria en un sujeto.

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de compuestos que modulan la función del CXCR3.

La solución propuesta por la presente solicitud consiste en compuestos derivados de pirimidinas fusionadas que son moduladores del receptor CXCR3.

El objeto de la solicitud definido anteriormente se clasificó en la IPC A61K 31/519; C07D 471/04; A61P 29/00, A61P 38/00.

4. De la solicitud de Patente

4.1. Descripción (artículo 28 D. 486)

De acuerdo con lo revelado en la descripción, el título de la solicitud debe hacer alusión al núcleo principal de los compuestos que se pretenden proteger y no a la actividad terapéutica o uso farmacológico de los mismos.

4.2. Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

De acuerdo con lo revelado en el capítulo reivindicatorio, hay términos que no son concisos como por ejemplo: "heteroarilo", "heteroalquilo", puesto que no se mencionan el número de carbonos y/o heteroátomo(s).

La reivindicación 1 es bastante general y se contempla un número elevado de compuestos que pueden no estar suficientemente soportados por la descripción.

5. Excepciones de Patentabilidad (artículo 20 D486 literal a)-d))

De acuerdo con lo anterior, la(s) reivindicación(es): 46 a 52 (folios: 75 y 76), que se refiere(n) a un método para tratar una afección o enfermedad inflamatoria o inmunitaria en un sujeto, no es (son) patentable(s) porque se refieren a un método de tratamiento terapéutico.

6. Análisis de la(s) Oposición(es): (artículo 43 D. 486)

No se presentaron oposiciones al objeto reivindicado.

7. Determinación del Estado de la Técnica:

La fecha que se ha tenido en cuenta para determinar el Estado de la Técnica es:

Fecha de presentación de la solicitud prioritaria 28-06-2004.

Teniendo en cuenta la fecha indicada, se buscaron documentos del estado de la técnica relacionados, con fecha de publicación anterior a esta.

Se encontró como anterioridades que pueden afectar la patentabilidad del objeto de la presente solicitud:

Nº	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	US2003/055054	CXCR3 antagonists	20 de marzo de 2003
D2	WO 02/083143	CXCR3 antagonists	24 de octubre de 2002
D3	WO 01/98278	Methods and compositions utilizing quinoxalinones	27 de diciembre de 2001
D4	WO 01/16114	compounds and methods for modulating CXCR3 function	8 de marzo de 2001

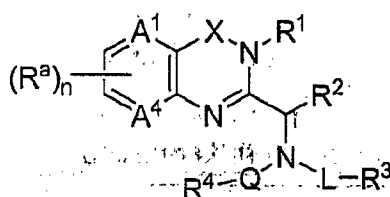
8. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

8.1. Novedad (artículo 16 D486)

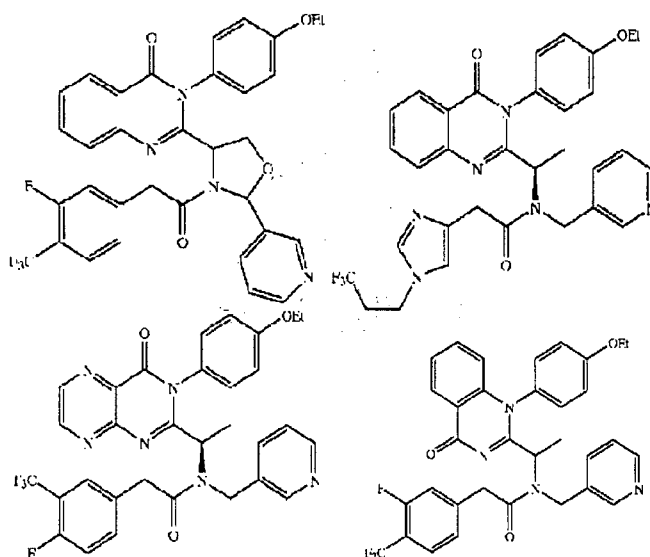
Comparando elemento por elemento el objeto de esta solicitud con lo mencionado en las anterioridades, tenemos que:

La presente Solicitud de Patente Colombiana No. 0707670, se refiere a:

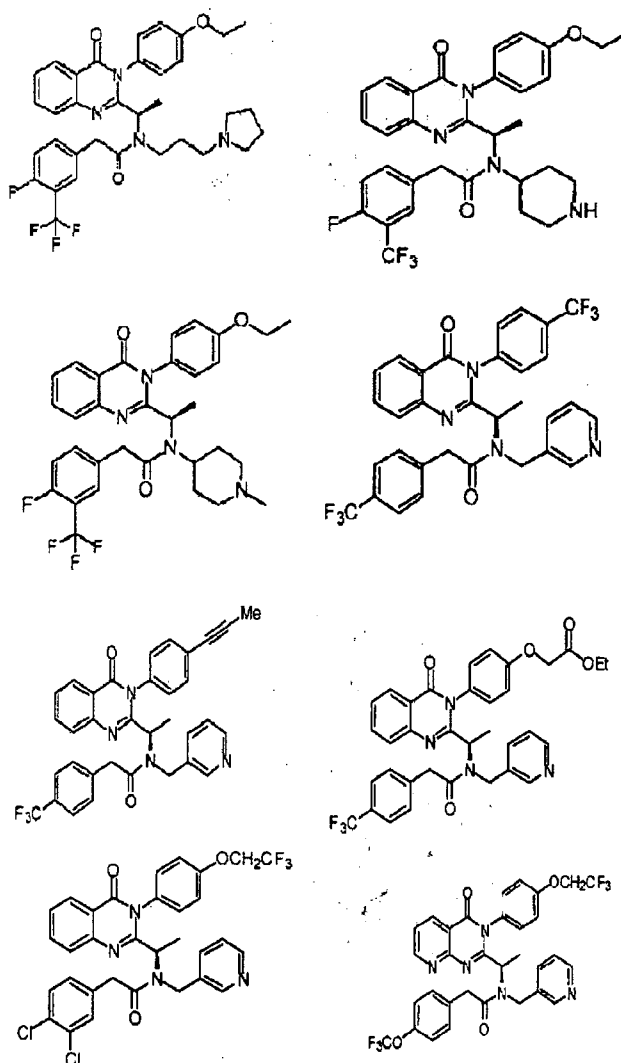
Compuestos derivados de pirimidina de fórmula I:



La anterioridad: US 2003/055054 (folios: 136 a 139), se relaciona con: composiciones que comprenden compuestos agonistas alfa-2-adrenérgicos que son derivados de quinaxolina. Este documento divulga algunos compuestos en los ejemplos: 6 a 11 que son compuestos específicos en relación con los revelados en la presente solicitud.



La anterioridad: WO 02/083143 (folios: 140 a 149), trata sobre: compuestos, composiciones y métodos y que son utilizados en el tratamiento de enfermedades inflamatorias e inmunes tales como esclerosis múltiple, diabetes tipo I, artritis; dichos compuestos son antagonistas del receptor CXCR3. Se encuentran algunos ejemplos específicos respecto de los compuestos de la presente solicitud.



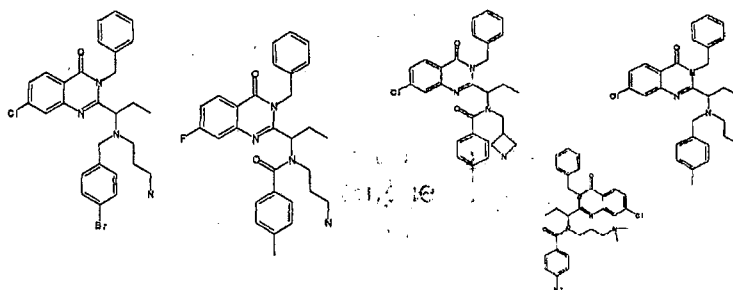
Como se puede observar, estos documentos revelan compuestos que son iguales a compuestos de la presente solicitud.

El elemento característico de los derivados de pirimidina reivindicados, ya era conocido en D1 y D2; por lo cual los compuestos de las reivindicaciones 1 a 45 no pueden considerarse nuevos.

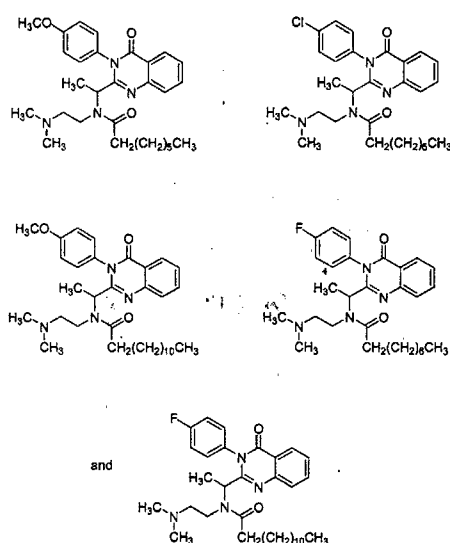
8.2. Nivel inventivo (artículo 18 D486)

La presente Solicitud de Patente reivindica lo siguiente: compuestos derivados de pirimidina que son moduladores de los receptores CXCR3, por lo cual se emplean para el tratamiento de enfermedades tales como: esclerosis múltiple, artritis reumatoidea, aterosclerosis y asma.

La anterioridad WO 01/98278 (folios: 150 a 159) revela compuestos semejantes a los de la presente solicitud, en donde la diferencia radica en los significados para R3 y R4 de la solicitud en estudio.



El documento WO 01/16114 (folios: 160 y 161) este documento enseña algunos compuestos que son muy similares a los de la presente solicitud. En la página 12 de dicho documento (folio: 161) se observa un compuesto específico pero difiere de los de la solicitud por la definición de R3, no obstante tienen actividad farmacológica similar.



El problema técnico planteado en esta solicitud: la necesidad de compuestos que modulan la función del CXCR3, se había resuelto previamente mediante compuestos derivados de pirimidina mediadores del receptor CXCR3 ya conocidos(as). Por esta razón se considera que las sustituciones de las pirimidinas reivindicadas en la presente solicitud son evidentes para una persona medianamente versada en la materia.

La(s) reivindicación(es) 1 a 45 (folios: 67 a 75) de esta solicitud no menciona(n) una característica que conceda un efecto inesperado o especial a los compuestos, que pueda considerarse como un aporte a la técnica, así que son obvios(as) para una persona versada en la materia.

Además, puesto que D3 y D4 divulgaban previamente derivados de pirimidinas (folios: 150 a 161), una persona conocedora de la materia motivada por tal sugerencia lograría el objeto de esta solicitud compuestos de pirimidina; de manera que para una persona medianamente versada en la materia sería obvio combinar estos dos documentos. Por lo cual puede no haber Nivel Inventivo.

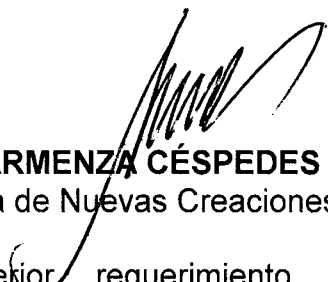
9. Conclusión:

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

Nº	Documento Nº	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	US2003/055054	1 a 45	Novedad
D2	WO 02/083143	1 a 45	Novedad
D3	WO 01/98278	1 a 45	Nivel Inventivo
D4	WO 01/16114	1 a 45	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 días contados a partir de la fecha de la 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 Nº 10 de 2001.


ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Directora de Nuevas Creaciones (c)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha _____ **23 JUL. 2010**

CONCEPTO TÉCNICO No. 2571	EXAMINADOR TÉCNICO Código No. 202005
----------------------------------	--