

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO			
RAD:	13-171786- -6	FECHA:	2014-06-05 15:25:31
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)
ALICIA LLOREDA RICAURTE

Asunto: Radicación: 13-171786- -6
 Trámite: 11
 Evento: 378
 Actuación: 519
 Oficio: 6701
 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/US2011/066972				
Fecha de Presentación Internacional	22/12/2011				

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 No 13-171786-00000-0000	19/Julio/2013
Reivindicaciones:	1 – 39 del radicado No. 13-171786-00000-0000	19/Julio/2013
Prioridad:	US 61 426 362	22/Diciembre/2010
	US 61 446 808	25/Febrero/2011

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.

Dado que en la presente solicitud se evidencia pago por reivindicación adicional, se procede a estudiar las 39 reivindicaciones del capítulo reivindicatorio.

Título de la solicitud: "INHIBIDORES DE LA FAAH".

El problema planteado en esta solicitud consiste en proporcionar compuestos derivados de indol y azaindol, inhibidores de la enzima hidrolasa de ácidos grasos (FAAH).

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona derivados de indol y azaindol, y composiciones farmacéuticas que los comprenden.

El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 401/12.

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

El objeto de las reivindicaciones 11 – 39 que se relacionan con métodos de tratamiento, no es patentable de acuerdo con el Art citado.

5. De la solicitud de patente

Título

El título no corresponde con el objeto de la solicitud porque se refiere al uso de los compuestos pero no al anillo principal que identifica tales compuestos y por lo tanto se sugiere a la solicitante hacer la corrección necesaria.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

Las reivindicaciones 2 – 7 no son claras porque hacen referencia a la "Tabla 1" y a los compuestos en ella incluidos, lo cual resulta ambiguo, impreciso y carente de claridad, por lo cual se sugiere señalar uno a uno los compuestos en cada reivindicación de su interés, o eliminarlas del pliego reivindicatorio.

Las reivindicación 9 y 10 no son concisas cuando mencionan "al menos un agente terapéutico adicional" y "en donde el agente terapéutico adicional se selecciona del grupo que consta de...", porque con todos esos grupos de compuestos se pueden presentar múltiples opciones de posibles composiciones farmacéuticas que

dificultan entender el objeto a proteger. Se sugiere reclamar una composición farmacéutica que contenga características técnicas esenciales relacionadas con los compuestos de interés o eliminar tales reivindicaciones del pliego reivindicatorio, para así darle concisión a la materia reclamada.

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 22 de diciembre 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 presentación
D1	US2010197708	"Indole compounds"	05/Agosto/2010

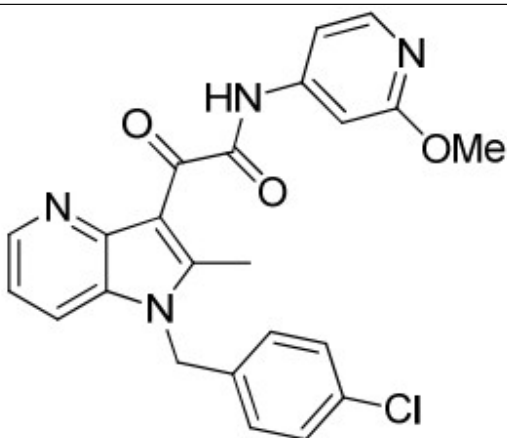
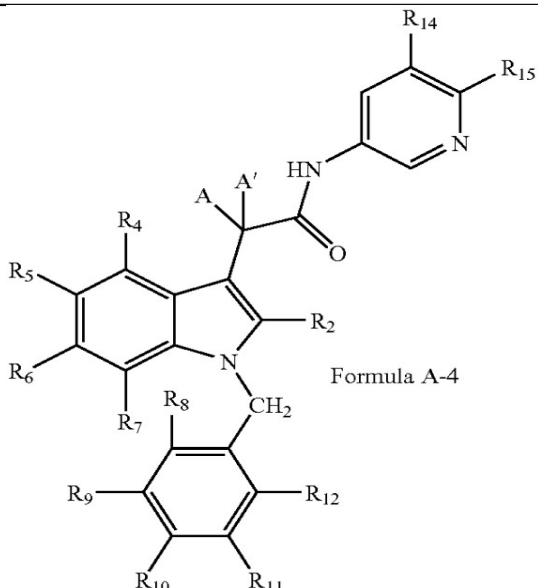
El documento D1 ¹ (resumen) divulga derivados de indol, derivados benzil y benzoil que actúan como inhibidores FAAH.

7. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en *"un compuesto seleccionado de la tabla 1 o una sal farmacéuticamente aceptable de él..."* (ver pág. 331 del radicado No. 13-171786-00000-0000)

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

Características esenciales	D1
	 Formula A-4

¹URL:http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2010197708A1&KC=A1&FT=D&ND=&date=20100805&DB=&locale=en_EP

	(pág. 8 y 9)
CH ₃	R ₂ es alquilo C ₁₋₃
Cl	R ₁₀ es halógeno
H	R ₄ , R ₅ , R ₆ , R ₇ , R ₈ , R ₉ , R ₁₁ , R ₁₂ , R ₅ , R ₄ , R ₁₅ son H.
-OCH ₃	R ₁₄ es -OCH ₃
=O	A y A' juntos son =O
pirrolo[3,2-b]piridin	No menciona sino que es un indol

El documento D1 es considerado el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1, ya que revela derivados de indol, derivados benzil y benzoil que actúan como inhibidores FAAH (D1: resumen, pág. 8 y 9, fórmula A-4).

La diferencia entre los compuestos de la invención y los revelados en D1 consiste en el anillo pirrolo[3,2-b]piridin reclamado en la presente invención, en lugar de un anillo indol que se presenta en D1.

No obstante, tal diferencia no concede un efecto técnico inesperado o una ventaja a los compuestos de la presente invención, ya que al revisar el capítulo descriptivo de la presente invención y comparar, por ejemplo, el ensayo de inhibición de FAHH (capítulo descriptivo, ver tabla 2), se encontraron datos que se encuentran en el mismo rango, tanto para los compuestos de la presente invención, como los que se encuentran en D1. Lo anterior puede demostrarse para el ensayo mencionado cuando en la presente invención se señala que los valores (IC₅₀) de los compuestos que mejor tienen actividad es de menos de 100nM y en el documento D1 en la evaluación de la actividad FAAH, se señala que los valores varían entre el 40 a 50 nM, para algunos de sus compuestos (D1, ver p. ej. Figura 3, Fila 4). Es decir, que no puede evidenciarse un efecto técnico inesperado o una ventaja demostrada cuando se realizan las modificaciones a los compuestos ya conocidos en el estado del arte.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿cómo obtener compuestos derivados de indol y azaindol, inhibidores de la enzima hidrolasa de ácidos grasos (FAAH), alternativos a los ya revelados en el arte previo?

El documento D1 ya revelaba compuestos que presentan actividad demostrada de inhibición FAAH, estructuralmente similares a los reclamados en la presente invención, particularmente puede observarse la figura A-4, en la cual se presentan sustituciones tales como clorobencil en la posición 1 del anillo, un metil en la posición 2 del anillo y un -N-(2-metoxipiridin-3-il) en la posición 3 del anillo principal. Adicionalmente, la misma estructura de la fórmula A señala que en el anillo bicíclico conformado por V, W, X, Y, Z, J, K, L y M, éstos pueden ser independientemente N o C, es decir que se podría presentar un anillo tal como el reclamado en la presente invención (D2: ver pág. 3, fórmula A).

En este punto vale la pena anotar que las sustituciones en compuestos heterocíclicos conocidos, en los sustituyentes y en sus heteroátomos, son labores de rutina para la persona del oficio normalmente versada en la materia, quien con

sus conocimientos en química heterocíclica y a partir de la bibliografía básica puede realizar cambios en los anillos como ocurre con los isómeros clásicos en donde los grupos y átomos univalentes pueden ser reemplazados como una opción alternativa de modificación de sustituyentes funcionales o anillos equivalentes ², es decir, que se sabe que con algunas modificaciones en los anillos ya conocidos se pueden lograr cambios en las propiedades del compuesto íntimamente relacionadas con su actividad o con el efecto técnico a esperar como es, por ejemplo, incrementar la potencia o el índice (relación) terapéutica como el LD₅₀, ED₅₀ y LD₅₀ a partir de algunas modificaciones en la posición o en el tipo de heteroátomos del anillo. Lo anterior es importante, porque en la presente invención se propone una modificación estructural que simplemente es el intercambio de un átomo de carbono por uno de nitrógeno en el anillo principal, pero como se vio anteriormente, tal modificación no mejoró la actividad de los compuestos de la presente invención, puesto que la actividad es similar a la ya revelada para los compuestos de D1. Por ello no se puede observar una ventaja o efecto inesperado comprobado.

En consecuencia, cualquier persona normalmente versada en la materia al observar los compuestos de la anterioridad D1, que actúan como inhibidores de la enzima hidrolasa de ácidos grasos (FAAH), habría podido “proponer” nuevos compuestos similares a los ya conocidos en el arte previo, como una alternativa para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 – 10 no mencionan características inventivas adicionales, se considera que tales reivindicaciones tampoco tienen nivel inventivo.

8. Conclusión

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

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	US2010197708	1 – 10	Nivel Inventivo

² Silverman, R. B., “The organic Chemistry of Drugs Design and Drug Action”. Elsevier. Northwestern University. Second Edition. Evanston Illinois. 2004. pág. 29, table 2.2.

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 2014-06-10

Elaboró: Nelson Ricardo Velasco Gonzalez
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Roza