

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
J. IAN RAISBECK

ASUNTO	Radicación	08 054 915
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	519
	Oficio	10478
	Folios	14

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad
Via Nacional		
Via PCT (Fase Nacional)	☒ Capítulo I	☒ Capítulo II
No. Solicitud Internacional	PCT/EP2006/011727	
Fecha de Presentación Internacional	27/Noviembre/2006	

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:	Folios 29 a 53	29/Mayo/2008
Reivindicaciones:	Folios 54 a 59	29/Mayo/2008
	Folios 61 a 67	29/Mayo/2008
	Folios 104 a 107	25/Agosto/2008
Oposiciones:	Folios 110 a 160	LafrancoI 06/Abril/2010
Prioridad:	DE 10 2005 057 421.1	30/Noviembre/2005

2. Análisis de la Prioridad

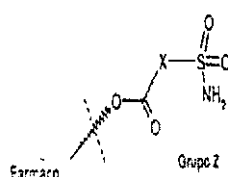
Se acepta la reivindicación de prioridad porque esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "Prodrogas de sulfonamida heteroaromática".

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar profármacos.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona profármacos de sulfonamida de fórmula:



El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K31/565//31/5685, A61P15/02//15/08//35/00//43/00.

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

El uso de las reivindicaciones 10 - 16 no es patentable, de acuerdo con el Art 14.

5. De la Solicitud de Patente

Titulo

El título no es claro porque emplea el término "prodrogas" el cual no es de uso común en el sector farmacéutico, se sugiere sustituirlo por el término "profármacos".

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 no es clara, ni concisa por la definición de la invención en términos de radicales "heteroaromáticos", o "alquil heteroaromáticos", para los cuales no se definen los átomos de carbono, ni los heteroátomos que los conforman. Se sugiere definir los radicales de manera precisa de tal manera que pueda definirse claramente el objeto de la invención, así como restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que ha sido sintetizado ó probado, es decir, que se encuentran debidamente soportados.

Las reivindicaciones 1, 3 y 7-9 no son claras, ni concisas cuando se utilizan términos como "compuesto activo para uso farmacéutico que puede formar un éster de ácido carboxílico por medio de un grupo OH", "compuesto esteroideal", "esteroides", "gestágenos", "anti-gestágenos", "corticoides", "modulador del receptor de progesterona", "mesoprogestinas", ya que se definen el profármaco y los componentes de la composición por su función pero no por un compuesto como tal, lo que hace que se obtengan un número indefinido de profármacos y composiciones que no encuentran soporte en la descripción. Se solicita restringir el alcance de la reivindicación a componentes específicos.

Las reivindicaciones 3, 9 y 17 no son claras porque emplean los términos "por ejemplo", "en particular", "preferentemente" o "tal como", los cuales al preceder una característica no son limitativos, porque hacen opcional a la característica y no limitan el alcance de la reivindicación. Se sugiere incluir las características opcionales o preferentes en una reivindicación dependiente.

La reivindicación 5 no es clara porque se refiere a la acción terapéutica deseada, la cual "tiene lugar mediante la liberación, en particular clivaje hidrolítico, del compuesto activado contenido en la prodroga o sus metabolitos", que es un resultado a alcanzar, no define a los compuestos porque la invención no queda definida por el resultado a alcanzar, puesto que la reivindicación incluiría no sólo la solución propuesta por el solicitante, sino todas las alternativas presentes o futuras que lleguen a ese

resultado. Se sugiere reemplazarlo por las características esenciales, estructurales o funcionales, que contribuyen a la obtención de ese efecto.}

Las reivindicaciones 6 y 17 no son claras porque emplean los términos "al menos" y "opcionalmente", los cuales son imprecisos, por lo cual no permite distinguir la invención del estado de la técnica. Se sugiere sustituirlo por un término preciso o un rango concreto.

El capítulo reivindicatorio no está sustentado en la descripción porque no hay suficientes ejemplos que demuestren que se han obtenido los compuestos de fórmula I. Tampoco hay soporte que con todos los medicamentos se pueda producir un profármaco por su unión con el grupo Z conforme a lo definido para la fórmula I. En la descripción se encuentra soporte para los siguientes sustituyentes: **X** es piridina o tiofeno; **fármaco** es 3-hidroxiestra-1,3,5(10)trien-17 β -ilo, 3-oxandrost-4-en-17 β -ilo. Se solicita restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que ha sido sintetizado ó probado, es decir, que se encuentran debidamente soportados.

6. Análisis de la oposición

Argumentaciones de Lafrancol

Afirma el oponente que esta solicitud incumple con los requisitos indispensables para otorgársele el privilegio de patente de invención. Afirma el oponente que "en primer lugar, algunas se encuentran dirigidos al uso de los profármacos". En segundo aspecto, "carece de nivel inventivo al utilizar estrategias para modificar fármacos reconocidos con anterioridad en el estado de la técnica, tal y como es la formación de profármacos derivados de sulfonamida". Como prueba de lo anterior señala que en el estado de la técnica se encuentran algunos documentos que hacen mención explícita al uso de la sustitución de grupos sulfonamida para la obtención de profármacos de diversos compuestos activos: publicación internacional WO2003/041705, publicada el 22 de mayo de 2003, WO1999/33792, publicada el 08 de julio de 1999, WO2002/00167, publicada el 03 de enero de 2002 y WO2001/91797, publicado el 06 de diciembre de 2001.

Respuesta del solicitante

El solicitante no da respuesta a la oposición.

Respuesta del Examinador Técnico

El documento WO2003/041705, publicado el 22 de mayo de 2003, divulga una composición farmacéutica que comprende un profármaco de sulfonamida, el cual, se degrada ex vivo. El profármaco es de parecoxib. Si bien es cierto, el documento divulga profármacos de sulfonamidas, este no desvirtúa la novedad, ni el nivel inventivo de la solicitud, por lo tanto, no se considerará dentro del examen de patentabilidad.

El documento WO1999/33792, publicado el 08 de julio de 1999, enseña profármacos de sulfonamidas inhibidores de aspartil proteasa. Aunque el opositor tiene razón en que este documento enseña profármacos de sulfonamida, este no desvirtúa la novedad, ni el nivel inventivo, por lo tanto, no se tiene en cuenta en el examen de patentabilidad.

El documento WO2002/00167, publicado el 03 de enero de 2002 da a conocer formas modificadas de antiinflamatorios no esteroideos, los cuales, aunque corresponde a profármacos de sulfonamida, no comparten las características técnicas esenciales con la invención que desvirtúen su novedad o nivel inventivo. Por lo tanto, no se considerará dentro del examen de patentabilidad.

El documento WO2001/91797, publicado el 06 de diciembre de 2001, enseña profármacos de sulfonamida donde el fármaco corresponde a esteroides, los cuales comparten características esenciales con la invención. Como el documento desvirtúa el nivel inventivo de la solicitud se considerará dentro del examen de patentabilidad.

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 prioridad 30 de noviembre de 2005 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	Artículo ¹	Synthesis and anti-inflammatory evaluation of new sulfamoylheterocarboxylic derivatives	1996
D2	ES 2 256 256*	Compuestos que tienen un grupo sulfonamida y composiciones farmacéuticas que contienen estos compuestos.	26/03/2003

*Corresponde al documento WO2001/91797, publicado el 06 de diciembre de 2001.

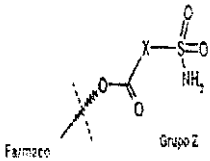
D1 divulga (Tabla 1 y 2, compuestos 9a y 9c) compuestos caracterizados porque comprenden un tiofeno sustituido por un éster de ácido carboxílico

D2 http://www.espatentes.com/pdf/2256256_t3.pdf, divulga (pg. 4, lns 8-11, pg. 6, lns 11-25, pg. 8, ln 20 – pg. 9, ln 2 y reivindicaciones) profármacos de sulfonamida cuyo fármaco es un esteroide y composiciones farmacéuticas que los contienen.

8. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

La reivindicación 1 consiste en profármacos de sulfonamida de fórmula general I:



Comparación de las características técnicas esenciales, con las del Estado de la Técnica:

Características esenciales	D1
Compuestos de fórmula I: 	Compuesto de fórmula: (Tabla 1, compuesto 9a)
Fármaco compuesto activo para uso farmacéutico que puede formar un éster de ácido carboxílico por medio de un grupo OH	-Me
X radical heteroaromático o alquil heteroaromático	Tiofenilo

¹ DÍAZ J., MORANTE M., VEGA S., DARIAS V., ABDALA S., DELGADO L., DE LAS HERAS B., VILLAR A., VIVAS J.; Synthesis and anti-inflammatory evaluation of new sulfamoylheterocarboxylic derivatives; Archiv der Pharmazie; Volume 329, Issue 5, 1996, Pages: 229–238.

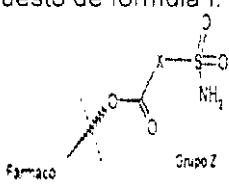
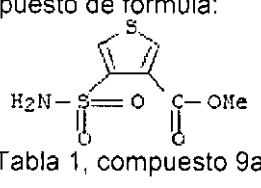
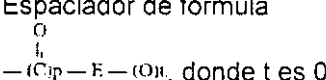
Las características esenciales del compuesto de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en D1, el cual enseña compuestos con actividad antiinflamatoria (Tabla 1 y 2, compuestos 9a y 9c) caracterizados porque comprenden un tiofeno sustituido por un éster de ácido carboxílico y un grupo sulfonamido, que coincide con los compuestos de fórmula I de la invención.

En consecuencia, la reivindicación 1 no es nueva, según lo divulgado en el documento D1.

La reivindicación dependiente 2 no menciona alguna característica que haga nueva a la composición de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no es nueva.

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 3 consiste en un profármaco de sulfonato de sulfamoilo de acuerdo con la reivindicación 1 donde Fármaco es esteroides como andrógenos, estrógenos o gestágenos.

Comparación de las características técnicas esenciales , con las del Estado de la Técnica:		
Características esenciales	D1	D2
Compuesto de fórmula I: 	Compuesto de fórmula:  (Tabla 1, compuesto 9a)	Compuesto de fórmula: Agente activo - Espaciador - SO₂NR¹R² (reivindicación 1). Donde R ¹ y R ² son H Espaciador de fórmula 
X es un radical heteroaromático o alquil heteroaromático	Tiofenilo	Arileno
Fármaco son esteroides como estrógenos, andrógenos o gestágenos	No se menciona	Agente activo se selecciona preferiblemente andrógenos, estrógenos, gestágenos, (pg. 4, lns 8-11, pg. 6, lns 11-25)

El documento D2 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulgan profármacos de sulfonamida cuyo fármaco es un esteroide y composiciones farmacéuticas que los contienen.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto de D2 consiste en que el grupo unido a la sulfonamida es un radical heteroaromático o alquil heteroaromático.

El efecto que logra el incluir esta característica es que logra mayores concentraciones del compuesto activo en sangre, por lo cual se alcanza la concentración terapéutica con dosis más bajas.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular como la necesidad de suministrar profármacos de sulfonamida alternativos a los ya conocidos en el estado del arte que alcancen mayores concentraciones del compuesto activo en sangre y alcancen la concentración terapéutica con dosis más bajas.

Sin embargo, es de conocimiento común para la persona del oficio normalmente versada en la materia que los profármacos son derivados químicos de los fármacos que se utilizan para modificar las propiedades fisicoquímicas de estos últimos,

mejorar su solubilidad, entre otros; también es conocido que para incrementar la solubilidad de fármacos poco solubles que tienen un grupo funcional hidroxilo, se convierten en su forma hidrofílica mediante la formación de ésteres, los cuales se activan in vivo². Además, el documento D2 divulga los compuestos 9a y 9c (tablas 1 y 2) que se caracterizan porque contienen un tiofeno sustituido por un éster de ácido carboxílico y un grupo sulfonamido, el cual corresponde al grupo Z de la invención.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, se vería suficientemente motivada a emplear sus conocimientos comunes con el fin de obtener profármacos de sulfonamida para mejorar la solubilidad de los esteroides y de los profármacos de D2, para esto cambiaría el grupo arileno por el tiofenilo de D1 y llegaría así al objeto de la reivindicación 3 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 4 - 9 y 17 - 19 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

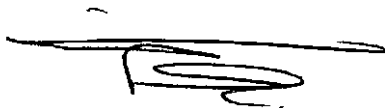
9. Conclusión

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

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	Artículo	1 - 2	Novedad
D1	Artículo	3 - 9 y 17 - 19	Nivel inventivo
D2	ES 2 256 256	3 - 9 y 17 - 19	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.

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
~~15 JUN. 2012~~

Elaborado por: Rubiela Pacanchique Vargas *o RLV*
Revisado por: Jacqueline Alfonso Rozo

² Rama Rao Nadendla; Principles of Organic Medicinal Chemistry; New Age International; 2005, pg. 31 - 35 (fls 164-171).