

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

2020
Bogotá, D.C.,

Abogada
DILIA MARIA RODRIGUEZ D'ALEMAN

ASUNTO	Radicación	08 108 659
	Trámite	011
	Evento	378
	Actuación	519
	Oficio	
	Folios	006

R 07233

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Vía Nacional	☒		
Vía PCT (Fase Nacional)	☒	Capítulo I	☒ Capítulo II ☐
No. Solicitud Internacional	PCT/US2007/007166		
Fecha de Presentación Internacional	21/Marzo/2007		

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 5 a 449	10/octubre/2008
Reivindicaciones:	Folios 450 a 602	10/Octubre/2008
Prioridad:	US 60 785, 415	21/Marzo/2006

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: "DERIVADOS DE 6,7,8,9-TETRAHIDRO-5H-PIRIMIDO[4,5-D]AZEPIN-4-ILJAMINA COMO MODULADORES DEL POTENCIAL TRANSITORIO DE RECEPTOR VALLINOIDE 1 PARA EL TRATAMIENTO DEL DOLOR".

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar compuestos moduladores del potencial transitorio de receptor vallinoide 1.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un Expediente 08 108 659 1er Art 45

compuesto de la fórmula (I) y composiciones que lo contienen.

El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 487/04.

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

El objeto de las reivindicaciones 108 a 115 no es patentable porque se refiere a un método de tratamiento.

5. De la Solicitud de Patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 no es concisa porque: términos como por ejemplo, cicloalquilo monociclo saturado, heterocicloalquilo monociclo saturado, heterocicloalquilobicíclico de puente, heteroarilo monocíclico, entre otros, son ambiguos y no definen a los compuestos de manera inequívoca y como consecuencia presenta una excesiva complejidad, lo cual dificulta determinar la extensión del objeto que se busca proteger.

RADICALES Y VARIABLES	SOPORTE DE LOS EJEMPLOS PRESENTADOS
R1	H, cicloropilo, metilo, etilo,  ,  ,  ,  , NH2, -S-, -SO2,  ,  , -O-
R2	H
R3	 ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  , 
Ar	 ,  ,  ,  ,  ,  ,  , 

Conforme a lo mencionado antes es necesario, que los sustituyentes de cada variable sean definidos de forma específica, y que se haga una generalización razonable de los compuestos reclamados (tomando como sustento los ejemplos), que resuelvan el problema planteado, con la actividad biológica que se les atribuye; así mismo, este requerimiento, para las reivindicaciones dependientes de la 1.

Por lo tanto se requiere al solicitante para que haga las aclaraciones necesarias.

La reivindicación 1 reclama, además, los profármacos y un metabolito farmacéuticamente activo del compuesto de fórmula (I) pero se observa que de dichos profármacos o el metabolito, no existe soporte en la descripción.

Las reivindicaciones dependientes mencionan que el compuesto está caracterizado además, como si se agregara otro significado además de los ya mencionados en la reivindicación 1, por lo tanto se recomienda eliminar la palabra además.

La reivindicación 51, es repetición de la reivindicación 1.

Las reivindicaciones 99 y 100, muestran a un listado de compuestos que se entiende corresponden al compuesto de la fórmula (I), por lo tanto no sugiere hacerlas dependientes de la reivindicación 1.

Las reivindicaciones 101 y 102 no son concisas porque no definen qué compuesto de la reivindicación 1 se esta reivindicando, además ya estos compuestos están incluidos en la formula (I), por lo anterior se sugiere eliminarlas.

Las Reivindicaciones 103 a 107, que se refieren a composiciones del compuesto de fórmula (I), están caracterizadas por un uso, lo cual no es la forma correcta de definir las características técnicas esenciales de una composición.

Se requiere al Solicitante hacer las aclaraciones necesarias.

Descripción (Art 28 D 486)

La Descripción no divulga la invención de manera suficientemente completa para que el la persona del oficio normalmente versada en la materia pueda ejecutarla ya que en esta no se muestran estructuras de profármacos y de un metabolito farmacéuticamente activo del compuesto de fórmula (I), ni su forma de obtención.

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 prioridad: Marzo 21 de 2006 y se encontraron los siguientes documentos que anticipa el objeto de esta solicitud:

Nº	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	WO2005014558	Condensed pyrimidine compounds as inhibitors of voltage-gated ion channels	Febrero 17 de 2005
D2	WO2005066171	Bicycloheteroarylamine compounds as ion channel ligands and use thereof	Julio 21 de 2005

D1¹, enseña compuestos, derivados de pirimidinas condensadas, como moduladores de los canales de calcio y sodio, para tratar ciertos trastornos como el dolor (dolor agudo, crónico, inflamatorio o neuropático), del tracto gastrointestinal (síndrome de colon irritable) y del tracto urinario como la incontinencia.

D2², divulga compuestos, tetrahidronaftipiridina, capaces de modular los canales iónicos de mamíferos a saber, el canal de catión VR1 (conocido también como receptor vainiloide), utilizado como analgésico para tratar estados patológicos como el dolor originado por diferentes etiologías, (dolor agudo, inflamaciones y dolor neuropático) entre otras la migraña. Además se utilizan para el manejo de enfermedades como artritis, alzheimer, trastornos renales etc.

7. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

1, http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20050217&CC=WO&NR=2005014558A1&KC=A1
2, http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20050721&CC=WO&NR=2005066171A1&KC=A1
Expediente 08 108 659 1er Art 45

La reivindicación 1 consiste en un compuesto de fórmula (I), que son derivados de 6,7,8,9-Tetrahydro-5h-pirimido[4,5-d]azepin-4-il]amina.

Comparación de las características técnicas **esenciales**, de la reivindicación 1, con las del Estado de la Técnica:

Características esenciales	D1
(I) Cuando: R1=monociclo de 5 a 6 miembros R2=alquiloC1-6 R3=monocicloC3-7 CHR4 CHR4 N-Ar CHR4	(IV) Cuando: A= monociclo de 5 a 6 miembros R1= alquiloC1-6 R2=monocicloC3-7 X1= CHR4 X2= CHR4 X3=NR3 R3=R' R'=Arilo C6-10, heteroarilo5-10 miembros(biciclo) X=CHR4 p=2,

Las características **esenciales** del compuesto de la reivindicación 1, habían sido divulgadas previamente en D1 (párrafos 105 y 106).

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

Las reivindicaciones dependientes 2 – 107 que no mencionan alguna característica que haga nueva al compuesto de la reivindicación 1, tampoco se consideran nuevas.

Nivel Inventivo (Art18 D486)

Se realiza el presente análisis de nivel inventivo, para algunas modalidades de la reivindicación 1 [del compuesto de fórmula (I)], por ejemplo cuando R1 tiene los significados mencionados a continuación.

Comparación de las características técnicas **esenciales**, de la reivindicación1, con las del Estado de la Técnica:

Características esenciales	D1	D2
(I)	(IV)	(1)
R1=alquil, NRaRb (Ra y Rb son H=Amino), O-alquilo C1-6	A= no menciona	Z= CR4 R4=alquil, Amino, alcoxy

(alcoxy)		
R2=alquiloC1-6	R1= alquiloC1-6	R1= C1-6
R3=monocicloC3-7	R2=monocicloC3-7	R2= monocicloC1-6
CHR4	X1= CHR4	A=CH2
CHR4	X2= CHR4	B= CH2
N-Ar	X3=NR3 R3=R' R'=Ariilo C6-10, heteroarilo5-10 miembros(biciclo)	N-R3
CHR4	X=CHR4	Y=CH2
	p=2 	

Los documentos D1 y D2 constituyen el estado de la técnica cercano a la invención.

El documento D1 constituye el estado de la técnica cercano a la invención porque da a conocer el compuesto de formula (I), derivados de tetrahidronaftipiridina (párrafos 105 a 135), sus sales (párrafo 210), sus composiciones (párrafos 206 y 211), capaces de modular los canales iónicos de mamíferos a saber, tal como el canal de catión VR1 conocido también como receptor vainiloide, para tratar ciertos trastornos como el dolor (dolor agudo, crónico, inflamatorio o neuropático), del tracto gastrointestinal (síndrome de colon irritable) y del tracto urinario como la incontinencia (párrafo 207).

Estas modalidades del compuesto objeto de esta solicitud se diferencian de los de D1, en que R1 puede ser por ejemplo: alquil, N_RA_Rb (R_a y R_b son H=Amino), O-alquilo C1-6 (alcoxy).

No obstante la anterior diferencia, no se observa ningún efecto inesperado ya que los compuestos reivindicados presentan la misma actividad, como moduladores del canal de catión VR1.

Por tanto, el Problema Técnico Objetivo consiste en "cómo modificar el compuesto de D1, para obtener compuestos alternativos con actividad como moduladores del canal de catión VR1".

Sin embargo, D2 ya divulgada compuestos derivados de pirimidinas condensadas y sus composiciones (párrafos 20 a 22), como moduladores de los canales de calcio y sodio, para tratar ciertos trastornos como el dolor (dolor agudo, crónico, inflamatorio o neuropático), del tracto gastrointestinal (síndrome de colon irritable) y del tracto urinario como la incontinencia, con un IC₅₀ de <100nM, al igual que el de los compuestos reivindicados [(D2 pág.137, ejemplos 3,4,5,6; pág.141 ejemplos 28 y 29; pág.145, ejemplos 56 y 60).

De acuerdo a lo anterior la persona del oficio normalmente versada en la materia enfrentada al problema de "cómo modificar el compuesto de D1, para obtener compuestos alternativos con actividad como moduladores del canal de catión VR1, conocido también como receptor vainiloide", incluiría los significados de R1 en los compuestos de D1 que se enseñaban en D2(Z= CR4 R4=alquil, Amino, alcoxy), para llegar a obtener los compuestos de fórmula (I) objeto de esta solicitud.

Por lo cual las modalidades nuevas del compuesto, de la Reivindicación 1 carecen de Nivel Inventivo y, por ende, no cumplen lo dispuesto en el artículo 18 de la Decisión 486.

Por lo demás, como quiera que las reivindicaciones dependientes 2 a 107 no mencionan características inventivas adicionales, tampoco pueden ser consideradas inventivas.

8. Conclusión

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

Nº	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2005014558	1-107	Nivel Inventivo
D2	WO2005066171	1-107	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.

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.

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 07 MAYO 2012

Elaborado por: Lyna del Carmen Mordecay Dunoyer
Revisado Por: Gloria Jacqueline Alfonso Rozo 
Aprobado por: José Luis Salazar López.