

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 680 418**

21 Número de solicitud: 201730249

51 Int. Cl.:

A61K 31/52 (2006.01)

A61K 31/4192 (2006.01)

A61K 31/05 (2006.01)

A61K 31/53 (2006.01)

12

INFORME SOBRE EL ESTADO DE LA TÉCNICA

R1

22 Fecha de presentación:

24.02.2017

43 Fecha de publicación de la solicitud:

06.09.2018

88 Fecha de publicación diferida del informe sobre el estado de la técnica:

17.01.2019

71 Solicitantes:

FUNDACIÓN RIOJA SALUD (60.0%)
C/ Piqueras, 98 Edificio Cibir
26006 LOGROÑO (La Rioja) ES;
FUNDACIÓN UNIVERSITARIA SAN PABLO CEU
(25.0%);
FABIÁN LOIDL, César (7.5%) y
REY FUNES, Manuel Eduardo (7.5%)

72 Inventor/es:

FABIÁN LOIDL, César;
REY FUNES, Manuel Eduardo;
MARTINEZ RAMIREZ, Alfredo;
LARRÁYOZ ROLDÁN, Ignacio;
PELÁEZ CRISTÓBAL, Rafael;
DE PASCUAL TERESA, Beatriz;
RAMOS GONZÁLEZ, Ana María;
CODERCH BOUÉ, Claire y
ZAPICO RODRÍGUEZ, Jose María

74 Agente/Representante:

CARVAJAL Y URQUIJO, Isabel

54 Título: **Uso de un compuesto en la fabricación de un medicamento útil para el tratamiento por activación de la expresión de la proteína CIRP de una enfermedad y composición**

57 Resumen:

Uso de un compuesto en la fabricación de un medicamento útil para el tratamiento por activación de la expresión de la proteína CIRP de una enfermedad y composición. Uso de un compuesto en la fabricación de un medicamento útil para el tratamiento por activación de la expresión de la proteína CIRP (ribonucleoproteína heterogénea A18 [hnRNP A18]) de una enfermedad de un animal homeotermo. Composición que comprende el compuesto y uso de la composición.

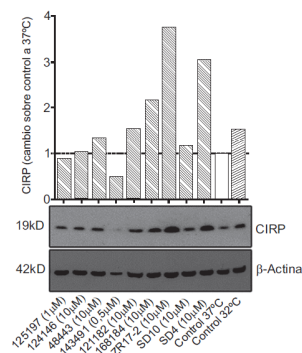


Fig. 1



- ②① N.º solicitud: 201730249
②② Fecha de presentación de la solicitud: 24.02.2017
③② Fecha de prioridad:

INFORME SOBRE EL ESTADO DE LA TÉCNICA

⑤① Int. Cl.: Ver Hoja Adicional

DOCUMENTOS RELEVANTES

Categoría	⑤⑥ Documentos citados	Reivindicaciones afectadas
A	MASLYK, MACIEJ et al. In search of a new prototype in ck2 inhibitors design. ARKIVOC, 2010, Vol. iii, Páginas 54-71, <DOI: http://dx.doi.org/10.3998/ark.5550190.0012.306 >. Esquema 1, compuestos 8 y 9	1-7
A	NOELL C W et al. Potential purine antagonists. xxxi. the preparation of certain 9-alkyl-2-amino-6-purinethiols and related derivatives as antitumor agents.. Journal of medicinal and pharmaceutical chemistry United States May 1962. 30/04/1962, Vol. 91, Páginas 558 - 588, ISSN 0095-9065 (Print), <DOI: pubmed: 14056392>. Página 563, fórmula X, Tabla V.	1-7
A	DEMKOWICZ, Sebastian et al. New clicked full agonists of the estrogen receptor beta. The Royal Society of Chemistry, 2013, Vol. 3, Páginas 3697-3706, <DOI: 10.1039/c3ra00122a>. Figura 2	1-7
A	Pagliai Francesca et al. Rapid synthesis of triazole-modified resveratrol analogues via click chemistry. Journal of Medicinal Chemistry JAN 26 2006. 26/01/2006, Vol. 49, Nº 2, Páginas 467-470, ISSN 0022-2623(print) ISSN 1520-4804(electronic), <DOI: doi: 10.1021/jm051118z>. Figura 1	1-7

Categoría de los documentos citados

X: de particular relevancia

Y: de particular relevancia combinado con otro/s de la misma categoría

A: refleja el estado de la técnica

O: referido a divulgación no escrita

P: publicado entre la fecha de prioridad y la de presentación de la solicitud

E: documento anterior, pero publicado después de la fecha de presentación de la solicitud

El presente informe ha sido realizado

☒ para todas las reivindicaciones

☐ para las reivindicaciones nº:

Fecha de realización del informe
08.01.2019

Examinador
H. Aylagas Cancio

Página
1/6



- ②① N.º solicitud: 201730249
②② Fecha de presentación de la solicitud: 24.02.2017
③② Fecha de prioridad:

INFORME SOBRE EL ESTADO DE LA TECNICA

⑤① Int. Cl.: Ver Hoja Adicional

DOCUMENTOS RELEVANTES

Categoría	⑤⑥ Documentos citados	Reivindicaciones afectadas
A	Koehler M G et al. A molecular shape analysis and quantitative structure-activity relationship investigation of some triazine-antifolate inhibitors of leishmania dihydrofolate reductase. archives of biochemistry and biophysics, 19881001 Academic Press, US. 01/10/1988, Vol.266, Nº 1, Páginas 152 - 161, ISSN 0003-9861, <DOI: doi:10.1016/0003-9861(88)90245-7>. Tabla I, compuesto a7.	1-7
A	BOOTH R G et al. Quantitative structure-activity relationship of triazine-antifolate inhibition of leishmania dihydrofolate reductase and cell growth. Journal of Medicinal Chemistry 1987. 30/11/1986, Vol. 30, Nº 7, Páginas 1218-1224, ISSN 0022-2623. Tabla I, compuesto 10	1-7
Categoría de los documentos citados X: de particular relevancia Y: de particular relevancia combinado con otro/s de la misma categoría A: refleja el estado de la técnica O: referido a divulgación no escrita P: publicado entre la fecha de prioridad y la de presentación de la solicitud E: documento anterior, pero publicado después de la fecha de presentación de la solicitud		
El presente informe ha sido realizado ☒ para todas las reivindicaciones ☐ para las reivindicaciones nº:		
Fecha de realización del informe 08.01.2019	Examinador H. Aylagas Cancio	Página 2/6

CLASIFICACIÓN OBJETO DE LA SOLICITUD

A61K31/52 (2006.01)

A61K31/4192 (2006.01)

A61K31/05 (2006.01)

A61K31/53 (2006.01)

Documentación mínima buscada (sistema de clasificación seguido de los símbolos de clasificación)

A61K

Bases de datos electrónicas consultadas durante la búsqueda (nombre de la base de datos y, si es posible, términos de búsqueda utilizados)

INVENES, EPODOC, WPI, NPL, EMBASE, MEDLINE, BIOSIS, XPESP, REGISTRY, CAPLUS

Fecha de Realización de la Opinión Escrita: 08.01.2019

Declaración

Novedad (Art. 6.1 LP 11/1986)	Reivindicaciones 1-7	SI
	Reivindicaciones	NO
Actividad inventiva (Art. 8.1 LP11/1986)	Reivindicaciones 1-7	SI
	Reivindicaciones	NO

Se considera que la solicitud cumple con el requisito de aplicación industrial. Este requisito fue evaluado durante la fase de examen formal y técnico de la solicitud (Artículo 31.2 Ley 11/1986).

Base de la Opinión.-

La presente opinión se ha realizado sobre la base de la solicitud de patente tal y como se publica.

1. Documentos considerados.-

A continuación se relacionan los documentos pertenecientes al estado de la técnica tomados en consideración para la realización de esta opinión.

Documento	Número Publicación o Identificación	Fecha Publicación
D01	MASLYK, MACIEJ et al .ARKIVOC, Vol. iii, Páginas 54-71, <DOI: http://dx.doi.org/10.3998/ark.5550190.0012.306 >	2010
D02	NOELL, C. W et al. Journal of medicinal and pharmaceutical chemistry United States May 1962. Vol. 91, Páginas 558 - 588, ISSN 0095-9065 (Print), <DOI: pubmed:14056392>	30.04.1962
D03	DEMKOWICZ, Sebastian et al. The Royal Society of Chemistry, Vol.3, Páginas 3697-3706, <DOI:10.1039/c3ra00122a>	2013
D04	PAGLIAI FRANCESCA et al. Journal of Medicinal Chemistry Vol. 49, Nº 2, Páginas 467-470, ISSN 0022-2623(print) ISSN:1520-4804(electronic), <DOI:doi:10.1021/jm051118z>	26.01.2006
D05	KOEHLER M G et al..Archives of biochemistry and biophysics, 19881001 Academic Press, US. Vol. 266, Nº 1, Páginas 152 - 161, ISSN 0003-9861, <DOI: doi:10.1016/0003-9861(88)90245-7>	01.10.1988
D06	BOOTH R G et al.Journal of Medicinal Chemistry 1987. Vol. 30, Nº 7, Páginas 1218-1224, ISSN 0022-2623	30.11.1986

2. Declaración motivada según los artículos 29.6 y 29.7 del Reglamento de ejecución de la Ley 11/1986, de 20 de marzo, de Patentes sobre la novedad y la actividad inventiva; citas y explicaciones en apoyo de esta declaración

La presente solicitud se refiere al uso de compuestos de fórmulas I, II, III, IV y V en la fabricación de un medicamento útil para el tratamiento por activación de la expresión de la proteína CIRP (ribonucleoproteína heterogénea A18) de una enfermedad de un animal homeotermo. Así mismo se reivindica la composición farmacéutica que comprende dichos compuestos.

Los documentos D1 y D2 se refieren a la síntesis de compuestos derivados de purinas, todos ellos con estructuras semejantes a las del compuesto de fórmula I de la reivindicación 1 (ver compuestos 7 y 8 del esquema 1 del documento D1 y ver compuesto X, página 563 y tabla V del documento D2). Los compuestos del documento D1 tienen actividad como inhibidores de CK2 y los del documento D2 como inhibidores de adenocarcinoma in vivo.

El documento D3 se refiere a la síntesis de compuestos 1,2,3 triazoles sustituidos por 1,4 difenilos y su uso como agonistas del receptor estrógeno beta. En la figura 2 el compuesto 2a y el compuesto 3b son exactamente los mismos compuestos de fórmula II de la reivindicación 3 cuando los radicales R4 y R5 son CF3 y OH o F y OH. Asimismo los compuestos 2c, 2d, 3c y 3d de la figura 2 entran dentro de la definición de la fórmula II de la reivindicación 1.

El documento D4 se refiere a compuestos derivados del resveratrol y modificados con la introducción de un grupo triazol (ver figura 1). Estos compuestos entran dentro del ámbito del compuesto de fórmula II de la reivindicación 1 mejorando las propiedades citotóxicas y antiproliferativas del resveratrol.

Los documentos D5 y D6 se refieren al compuesto derivado de triazina que se reivindica en las reivindicaciones 1 y 6 de la solicitud. El compuesto 17 de la tabla I (documento D6) y el compuesto 10 de la tabla I (documento D7) son exactamente el compuesto reivindicado. Se cita su actividad como inhibidores de la Leishmania dihidrofolato reductasa.

Por lo tanto, si bien algunos de los compuestos incluidos en las reivindicaciones de la solicitud son conocidos en el estado de la técnica, la actividad farmacológica reivindicada no se encuentra recogida en ninguno de los documentos citados ni deriva de ninguna combinación relevante de los mismos.

Por lo tanto, a la vista de los documentos citados, las reivindicaciones 1-7 de la presente solicitud tienen novedad y actividad inventiva según los artículos 6.1 y 8.1 de la L.P.