

Señores

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Bogotá, D C

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicación : 01028467 00000002 Folios: 8
Fecha (AMB) 2001-06-08 09:29:42
Trámite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 444 REPUESTA
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Re Código 02-01-444
Expediente No 01-28 467
Solicitud de Patente
SMITHKLINE-BEECHAM
CORPORATION

En relación con el Expediente de la referencia y dando cumplimiento a la última providencia recaída sobre este asunto por medio del presente escrito me permito manifestarles lo siguiente

- 1 Acompaño el documento de cesión de los inventores a la sociedad solicitante el cual encuentra legalizado por apostilla
- 2 La dirección completa de la sociedad solicitante es One Franklin Plaza, Filadelfia, Estado de Pennsylvania, E U A
- 3 Adjunto el arte final por triplicado

Renuncio al término faltante de traslado, y les solicito ordenar la publicación del extracto

De Ustedes Atentamente,

1

Página No 2

Expediente No 01-28 467

GERMAN CASTILLO GRAU
T P No 2978 del C.S.J.

702
188

APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

- 1 Country United States of America
2 This public document has been signed by Carol E Koennecker
3 acting in the capacity of Notary Public, Chester County
4 bears the seal/stamp Carol E Koennecker, Notary Public, Commonwealth of Pennsylvania

Certified

- 5 at Harrisburg, Pennsylvania 6 The 24th day of May, 2001
7 by Kim Pizzingrilli, Secretary of the Commonwealth of Pennsylvania

8 No 0112507

9 Seal/Stamp

10 Signature



Kim Pizzingrilli

Kim Pizzingrilli

703
189

APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

- 1 Country United States of America
- 2 This public document has been signed by Arlene E Cannon
- 3 acting in the capacity of Notary Public, Montgomery County
- 4 bears the seal/stamp Arlene E Cannon, Notary Public, Commonwealth of Pennsylvania

Certified

5 at Harrisburg, Pennsylvania

6 The 24th day of May, 2001

7 by Kim Pizzingrilli, Secretary of the Commonwealth of Pennsylvania

8 No 0112508

9 Seal/Stamp

10 Signature



Kim Pizzingrilli

Kim Pizzingrilli

4

Notarial Seal
Carol E Koennecker Notary Public
Unchion Twp., Chester County
My Commission Expires May 3, 2004

Signed at King of Prussia, Pennsylvania

Robert W. Marquis, Jr.

Robert W MARQUIS, Jr

Date

04-May, 2001

205
191

Commonwealth of Pennsylvania)

) ss

County of Montgomery)

Before me, a Notary Public, personally appeared Robert W MARQUIS, Jr known to me to be the person who executed the foregoing assignment and acknowledged it to be his/her act and deed

Witness my hand and seal this 4 day of May, 2001



Arlene E. Cannon

Signed at King of Prussia, Pennsylvania

Yu RU

Yu RU

Date

01/05/2001

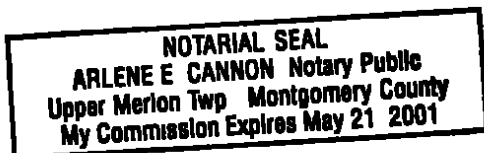
Commonwealth of Pennsylvania)

) ss

County of Montgomery)

Before me, a Notary Public, personally appeared Yu RU known to me to be the person who executed the foregoing assignment and acknowledged it to be his/her act and deed

Witness my hand and seal this 1 day of May, 2001



Arlene E. Cannon

Signed at King of Prussia, Pennsylvania

Scott K. Thompson

Scott K THOMPSON

Date

15-May-2001

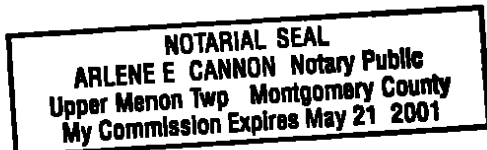
Commonwealth of Pennsylvania)

) ss

County of Montgomery)

Before me, a Notary Public, personally appeared Scott K THOMPSON known to me to be the person who executed the foregoing assignment and acknowledged it to be his/her act and deed

Witness my hand and seal this 15 day of May, 2001



Arlene E. Cannon

~~206~~
192

Date May 21 2007

Before me, a Notary Public, personally appeared Daniel F VEBER known to me to be the person who executed the foregoing assignment and acknowledged it to be his/her act and deed

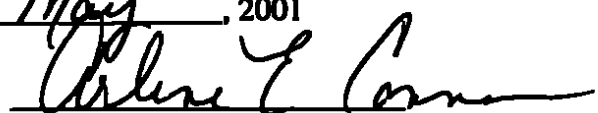
May, 2001
 Charles E. Corra



Date 03-May-2001

Before me, a Notary Public, personally appeared Dennis S Yamashita known to me to be the person who executed the foregoing assignment and acknowledged it to be his/her act and deed

Witness my hand and seal this 13 day of May, 2001



7



Expediente No		01028487	No de Follo
Item		No de unidades	✓
1	CD		
2	DVD		
3	REVISTA		
4	LIBRO		
5	PERIODICO		
6	DISQUETES		
7	SOBRE DE MANILA		
8	SOBRE BLANCO TAMAÑO CARTA		
9	SOBRE BLANCO TAMAÑO OFICIO	1	
10	OTROS		
Observaciones A la Final			



2do EXAMEN DE FORMA PATENTE DE INVENCION

Folio 208

Radicación no 01-28467

Concepto Técnico no 1894

Clasificación Internacional de Patentes. A 61 K 31/55

Practicado el examen de acuerdo a lo establecido en el Art. 38 de la Decisión 486 se determinó que esta solicitud de Patente de invención

- SI [☒] NO [☐] Contiene un resumen de la invención (Art26-e)
- SI [☒] NO [☐] Contiene el título o nombre de la invención (Art27-d)
- SI [☒] NO [☐] Contiene la descripción de la invención (Art26-b)
- SI [☒] NO [☐] NO ES APLICABLE [☐] Contiene los dibujos necesarios para comprender la invención (Art26-d)
- SI [☒] NO [☐] Contiene una o más reivindicaciones (Art26-c)
- SI [☐] NO [☐] NO ES APLICABLE [☒] Han sido desarrollados los productos y/o procedimientos a partir de recursos genéticos o de sus productos derivados de los que cualquiera de los Países Miembros es país de origen (Art 26- h)
- SI [☐] NO [☐] NO ES APLICABLE [☒] Los productos y/o procedimientos han sido obtenidos o desarrollados a partir de los conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas, afroamericanas, o locales de los países miembros, de acuerdo a lo establecido en la Decisión 391 y sus modificaciones y reglamentaciones vigentes (Art26-i)
- SI [☐] NO [☒] La invención se refiere a un producto relativo a un material biológico (Art26-j)
- SI [☐] NO [☐] NO ES APLICABLE [☒] La prioridad coincide con la materia reivindicada.
- SI [☒] NO [☐] CUMPLE LOS REQUISITOS TÉCNICOS

OBSERVACIONES Y OTROS SI [☐] NO [☒] ver hoja(s) anexa(s)

EXAMINADOR TÉCNICO
202049

Bogotá D C , 26 de Diciembre de 2002



2020
Bogotá DC

Doctor
GERMAN CASTILLO GRAU
Apoderado

REFERENCIA.	Radicación No	01-28467
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	416
	Oficio No	2317
	Folios	001

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en los artículos 26 y 27 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, y en las demás disposiciones vigentes sobre la materia, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de Comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial, conforme lo establece el artículo 40 de la misma Decisión

Cúmplase
Dado en Bogotá DC, a los **23** ENE 2003


CLARA DE JAIMÉS
Jefe (E) de la División de Nuevas Creaciones

202049

528

Carrera 13 No 27-00 Piso 5 y 10
Conmutador 394 12 21-2-3-4
Fax 281 31 25 e-mail: info@dic.gov.co
Santa Fe de Bogotá D C - Colombia

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

210

RADICACIÓN EXPEDIENTE No 01-28467

EL EXTRACTO DE LA PRESENTE SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION
FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No 528, DE
FECHA 30 DE MAYO DE 2003, EL TERMINO HABIL SEÑALADO POR LA LEY
EXPIRA EL 29 DE AGOSTO DE 2003

NOTA Dentro del plazo de los seis (6) meses siguientes a partir de la fecha de publicación en la gaceta de Propiedad Industrial, deberá solicitar y cancelar el examen de patentabilidad so pena de que la solicitud caiga en abandono, de acuerdo con lo establecido en el Artículo 44 de la Decisión 486/2000

SE PRESENTARON OPOSICIONES POR PARTE DE TERCEROS

SI ☐ ☐

NO ☐ **X** ☐

-----+
ACCION Consultar Siguiente Anterior Ir al detalle Primero
Ver el Siguiente Registro |

-----|
SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO SISTEMA DE PROPIEDAD |
FECHA 17/08/2006 |

-----|
CONSULTA ANUALIDADES EN TRAMITES
Radicacion 1 28467 Sec_Eve 0 Sec_Act 3 |
Fecha 2003-11-05 10 26 13 |
Tramite 2 PATENTES DE INVEN Evento 1
REGISTRO/DEPOSITO/CONCE |
Actuacion 538 Tipo Radicacion EN |
Solicitante CASTILLO GRAU GERMAN |

-----|
PAGOS
No Recibo Fecha Recibo VALor Cant Estado |
3 80157 04/11/2003 335000 00 1 U |

-----|
Encontrados (4/4) registro(s) |
-----+

212 / 198

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

2020/
Bogotá, D C ,

**Doctor
Germán Castillo Grau
Apoderado
SMITHKLINE BEECHAM CORPORATION**

12660
Oficio N°

REFERENCIA	Radicación	01 28467
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Folios	009

Como resultado del examen de patentabilidad de la solicitud de patente de invención N° 01 28467, realizado según el artículo 45 de la decisión 486 de la comisión de la Comunidad Andina, se notifica

1 DOCUMENTOS ESTUDIADOS

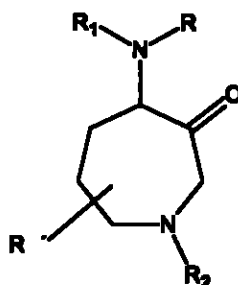
- El resumen y el capítulo descriptivo de la solicitud en los folios 192 y 5 a 76 respectivamente
- Los ejemplos que ilustran la invención en los folios 77 a 144
- Las cláusulas 1 a 104 relacionadas en el capítulo reivindicativo de la solicitud que se encuentran en los folios 145 a 191
- El primer examen de forma realizado a la solicitud de oficio No 1493, que se encuentra en el folio 199
- La respuesta al primer examen de forma, allegada mediante memorial de fecha 08/06/2001 que se encuentra en los folios 200 a 207
- El pago de examen de patentabilidad que aparece registrado en la fecha 04/11/2003 (número de recibo 80157) y se encuentra en el folio 211

2 OBJETO DE LA INVENCION

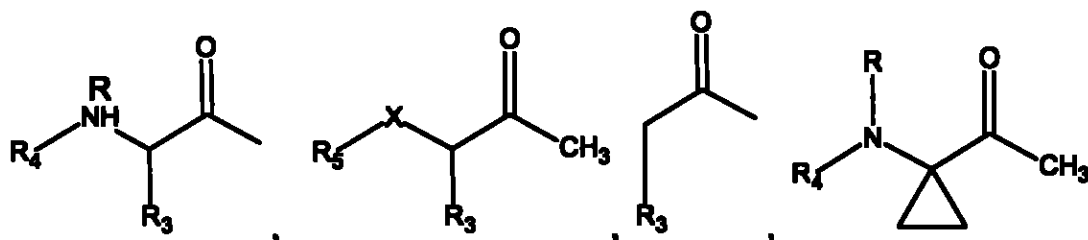
La solicitud hace referencia a un *"Inhibidores de proteasas"*

- **Reivindicaciones 1 a 53**

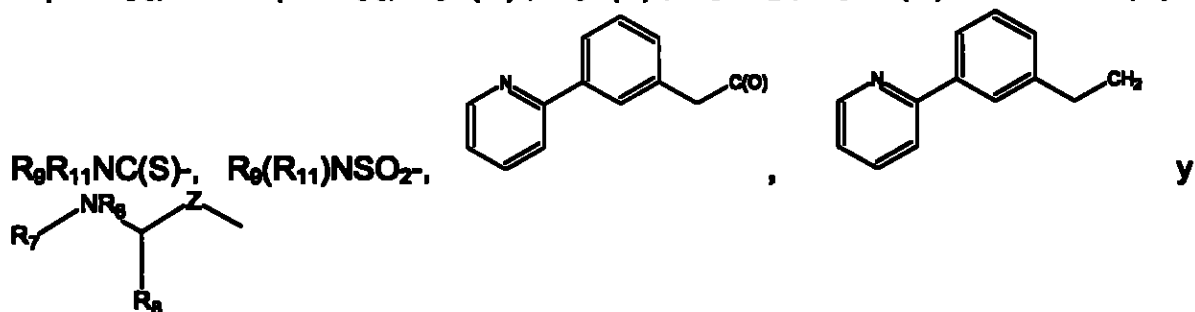
Se reivindica un compuesto de fórmula (I)



En el que R_1 se selecciona del grupo formado por

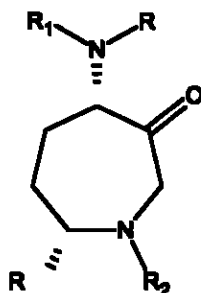


R_2 se selecciona del grupo formado por H, alquilo C_{1-6} , cicloalquil C_{3-6} , alquilo C_{0-6} , Ar-
alquilo C_{0-6} , Het-alquilo C_{0-6} , $R_9C(O)-$, $R_9C(S)-$, R_9SO_2- , $R_9OC(O)-$, $R_9R_{11}NC(O)-$,



Entre otros grupos sustituyentes

Además se reclama un compuesto de fórmula (Ia)



En particular se reclaman los compuestos

{(S)-3-metil-1-[(4S,6S)-6-metil-3-oxo-1-(piridil-2-sulfonil)azepan-4-ilcarbamol]butil}amida de ácido 5-metoxibenzofuran-2-carboxílico

{(S)-3-metil-1-[(4R,6R)-6-metil-3-oxo-1-(piridil-2-sulfonil)azepan-4-ilcarbamol]butil}amida de ácido 5-metoxibenzofuran-2-carboxílico

{(S)-3-metil-1-[(4S,7R)-7-metil-3-oxo-1-(piridil-2-sulfonil)azepan-4-ilcarbamol]butil}amida de ácido furo[3,2-b]piridil-2-carboxílico

{(S)-3-metil-1-[(4S,7R)-7-metil-3-oxo-1-(1-oxopiridil-2-sulfonil)azepan-4-ilcarbamol]butil}amida de ácido 3-metilbenzofuran-2-carboxílico

[(4S,7R)-7-metil-3-oxo-1-(1-oxopiridil-2-sulfonil)azepan-4-il]amida de ácido (S)-2-(5-ciclohexilpentanol)amino-4-metilpentanoico

{(S)-2-ciclohexil-1-[(4S,7R)-7-metil-3-oxo-1-(piridil-2-sulfonil)azepan-4-ilcarbamol]etil}amida de ácido 3-metilfuro[3,2-b]piridil-2-carboxílico

(tetrahidopirán-4-il)amida de ácido (2R,5S)-5-[(S)-2-[(1-benzofuran-2-ilmetanol)amino]-4-metilpentanolamino]-2-metil-6-oxoazepan-1-carboxílico

[(4S,7R)-7-metil-3-oxo-1-(piridil-2-sulfonil)azepan-4-il]amida de ácido 1-(3-ciclohexilpropanolamino)ciclohexanocarboxílico

En particular en la cláusula 53 se reclama el compuesto

{(S)-3-metil-1-[(4S,7R)-7-metil-3-oxo-1-(piridil-2-sulfonil)azepan-4-ilcarbamoi]butil}amida de ácido benzofuran-2-carboxílico

- **Reivindicación 54**

Se reivindica una composición farmacéutica que comprende un compuesto según las reivindicaciones 1 a 53 y un vehículo, diluyente o excipiente farmacéuticamente aceptable

- **Reivindicaciones 55 a 69**

Se reivindica un método para inhibir una proteasa, la cual se selecciona entre cisteína-proteasa (catepsina K o falcipaina) y serín-proteasa y que comprende administrar una cantidad eficaz de un compuesto según las reivindicaciones 1 a 53 a un paciente que lo necesita

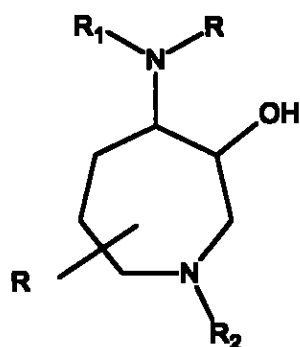
En particular se reivindica un método para tratar una enfermedad caracterizada por pérdida de masa ósea (como osteoporosis, periodontitis o gingivitis) que comprende inhibir dicha pérdida de masa ósea administrando una cantidad eficaz de un compuesto según las reivindicaciones 1 a 53 a un paciente que lo necesite

En otro aparte de la invención se reivindica un método para tratar una enfermedad caracterizada por excesiva degradación de cartílago o matriz como osteoartritis o artritis reumatoide, que comprende inhibir dicha excesiva degradación de cartílago o matriz administrando una cantidad eficaz de un compuesto según las reivindicaciones 1 a 53 a un paciente que lo necesita

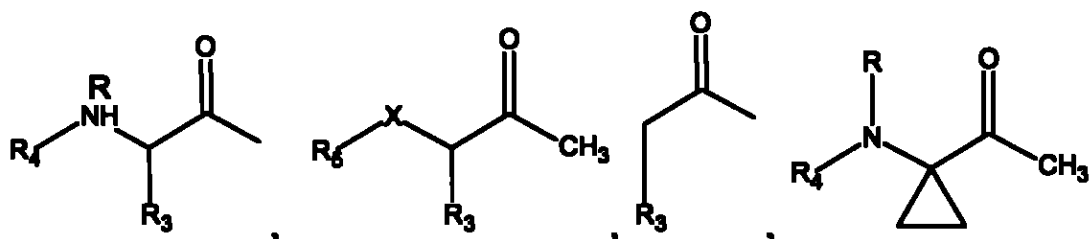
Además se reivindica un método para tratar una enfermedad caracterizada por infección con un parásito seleccionado del grupo formado por *Plasmodium falciparum*, *Trypanosoma cruzi*, *Trypanosoma brucei*, *Leishmania mexicana*, *Leishmania pifanoi*, *Leishmania major*, *Schistosoma mansoni*, *Onchocerca volvulus*, *Brugia pahangi*, *Entamoeba histolytica*, *Giardia lamblia*, los helmintos *Haemonchus contortus*, *Fasciola hepatica*, los hemilitos de los géneros *Spirometra*, *Trichinella*, *Necator* y *Ascaris*, y protozoos de los géneros *Cryptosporidium*, *Eimeria*, *Toxoplasma* y *Naegleria* causantes de enfermedades como malaria, tripanosomosis (tripanosomosis africana, enfermedad de Chagas) leishmaniasis, equistosomosis, oncocercosis y giardosis, el cual comprende inhibir la expresión de una cisteína-proteasa causante de dicha enfermedad administrando una cantidad eficaz de un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 53 a un paciente que lo necesita

- **Reivindicaciones 70 a 84**

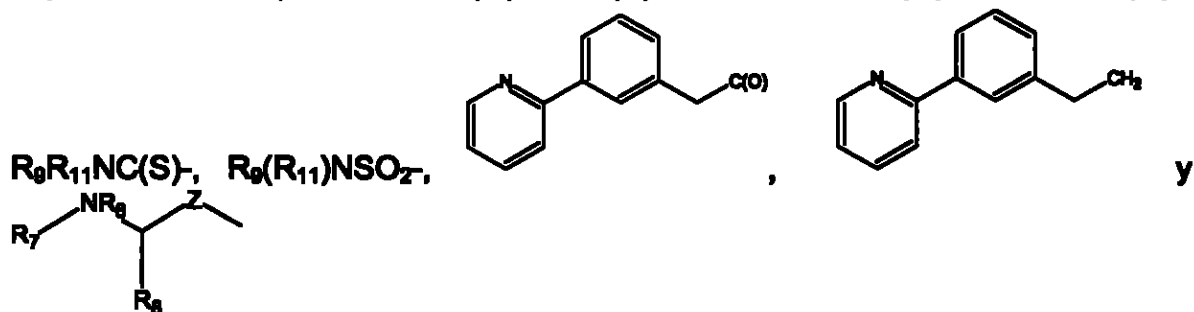
Se reivindica un compuesto de fórmula (II) que presenta la estructura



En el que R_1 se selecciona del grupo formado por



R_2 se selecciona del grupo formado por H, alquilo C_{1-6} , cicloalquilo C_{3-6} , alquilo C_{0-6} , Ar-alquilo C_{0-6} , Het-alquilo C_{0-6} , $R_9C(O)-$, $R_9C(S)-$, R_9SO_2- , $R_9OC(O)-$, $R_9R_{11}NC(O)-$,



Entre otros grupos sustituyentes

En particular en la cláusula 84 se reclaman los compuestos

3-metil-1-(piridil-2-sulfonil)-2,3,4,7-tetrahidro-1H-azepina

5-metil-3-(piridil-2-sulfonil)-8-oxa-3-azabicyclo[5.1.0]octano

4-azido-5-metil-1-(piridil-2-sulfonil)azepan-3-ol

Éster bencílico de ácido 5-amino-6-hidroxi-2-metilazepan-1-carboxílico

Éster bencílico de ácido alil-((R)-1-metilpent-4-enil)carbámico

{(S)-1-[(3S,4S,6S)-6-metil-3-hidroxi-1-(piridil-2-sulfonil)azepan-4-ilcarbamoil]-3-metilbutil}amida de ácido 3-metilbenzofuran-2-carboxílico

Éster bencílico de ácido (2R,5S,6S)-5-azido-6-hidroxi-2-metilazepan-1-carboxílico

{(S)-3-metil-1-[(3S,4S,7R)-7-metil-3-hidroxi-1-(piridil-2-sulfonil)azepan-4-ilcarbamoil]butil}amida de ácido quinolin-3-carboxílico

{(S)-3-metil-1-[(3S,4S,7R)-7-metil-3-hidroxi-1-(1-oxipiridil-2-sulfonil)azepan-4-ilcarbamoil]butil}amida de ácido 5-fluorobenzofuran-2-carboxílico

{{(S)-3,3-dimetil-1-[(3S,4S,7R)-7-metil-3-hidroxi-1-(1-piridil-2-sulfonil)azepan-4-ilcarbamoyl]butil}amida de ácido tofen-3-carboxílico

((3S,4S,7R)-1-ciclohexilmetil-7-metil-3-hidroxi-azepan-4-il)amida de ácido 1-(3-ciclohexilpropanoilamino)ciclohexanocarboxílico

Éster metílico de ácido (R)-2-[[1-(4-[(S)-2-[1-benzofuran-2-ilmetanoil]amino]-4-metilpentanoilamino)-3-hidroxi-azepan-1-il]metanoil]amino]-4-metilpentanoico

[(4S,7R)-7-metil-3-hidroxi-1-(piridil-2-sulfonil)azepan-4-il]amida de ácido 1-(3-ciclohexilpropanoilamino)ciclohexanocarboxílico

• **Reivindicaciones 85 a 90**

Se reivindica un procedimiento para la síntesis de un compuesto según la reivindicación 1, que comprende la etapa de oxidar un compuesto correspondiente de la reivindicación 70 con un oxidante para proporcionar el compuesto de fórmula (I) como una mezcla de diastereómeros

En particular se reivindica el procedimiento en el que el agente oxidante es el complejo dióxido de azufre-pindina y que comprende además la etapa de separar los diastereómeros por un medio de separación como cromatografía líquida de alta resolución (HPLC) y la etapa de deuteroar dichos diastereómeros con un agente deuteroante como CD3OD D2O (10 1) en trietilamina

• **Reivindicaciones 91 a 104**

Se reivindica el uso de un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 53, en la fabricación de un medicamento para uso en la inhibición de una proteasa seleccionada del grupo formado por un cisteína-proteasa (cathepsina K o falcipaina) y una senna-proteasa

En particular se reivindica el uso de un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 53, en la fabricación de un medicamento para uso en el tratamiento de una enfermedad caracterizada por pérdida de masa ósea, tal es el caso de osteoporosis, periodontitis o gingivitis

Además se reivindica el uso de un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 53 en la fabricación de un medicamento para uso en el tratamiento de una enfermedad caracterizada por excesiva degradación de cartilago o matriz como osteoartritis o artritis reumatoide

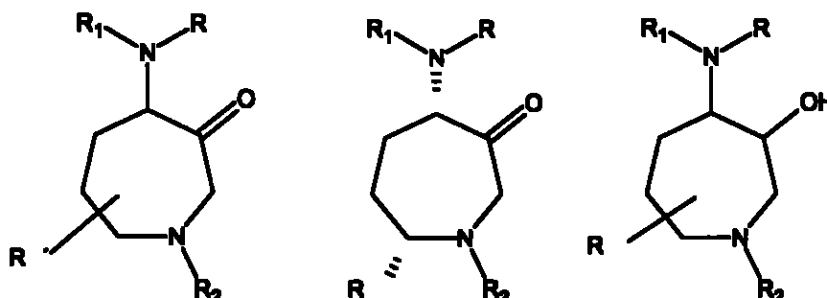
De otro lado se reivindica el uso de un compuesto de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 53 para la fabricación de un medicamento para tratar una enfermedad causada por infección con un parásito seleccionado del grupo formado por *Plasmodium falciparum*, *Trypanosoma cruzi*, *Trypanosoma brucei*, *Leishmania mexicana*, *Leishmania pifanoi*, *Leishmania major*, *Schistosoma mansoni*, *Onchocerca volvulus*, *Brugia pahangi*, *Entamoeba histolytica*, *Giardia lamblia*, los helmintos *Haemonchus contortus*, *Fasciola hepatica*, los helmintos de los géneros *Spirometra*, *Trichinella*, *Necator* y *Ascaris*, y protozoos de los géneros *Cryptosporidium*, *Elmeria*, *Toxoplasma* y *Naegleria* causantes de enfermedades como malaria, tripanosomosis (trpanosomosis africana, enfermedad de Chagas) leishmaniasis, equistosomosis, oncocercosis (ceguera de los ríos) y giardosis

Una vez catalogada la invención ésta se clasificó en la sección **A 61 K 31/35** de la **Clasificación Internacional de Patentes**

3 CLARIDAD DE LA SOLICITUD

El artículo 30 de la Decisión 486 contempla que *"Las reivindicaciones definirán la materia que se desea proteger mediante la patente. Deben ser claras y concisas y estar enteramente sustentadas por la descripción"*

- En atención al artículo 30 de la norma andina, se comunica al interesado la falta de claridad del capítulo reivindicatorio, teniendo en cuenta que los sustituyentes que se presentan a lo largo de las cláusulas 1 a 47 y 70 a 82 permite obtener compuestos de mayor complejidad química y estructural que los definidos por las fórmulas (I), (Ia) y (II)



Si bien es cierto, los compuestos presentan un anillo de 3-azepinona, la complejidad del anillo heterocíclico no es la suficiente como para definir todos los compuestos que se obtienen una vez se efectúan las correspondientes sustituciones sobre los radicales R₁, R₂, R, R.

Lo anterior se hace evidente cuando se evalúan las diferentes connotaciones químicas de los radicales citados y la diversidad química y estructural de los ejemplos que se presentan en las cláusulas 52 y 84

Por esta razón se remite al interesado a estudiar las connotaciones de los radicales primarios R₁, R₂, R, R, en especial de aquellos que comprenden sustituciones heterocíclicas, teniendo en cuenta que los compuestos de carácter heterocíclico se clasifican en atención al número de átomos que componen los anillos y a los heteroátomos y al número y tipo de ellos que comprenden, para ilustrar este hecho se remite al interesado a la bibliografía básica sobre compuestos heterocíclicos, en la que encontrará una de las clasificaciones empleadas para comprender la amplitud de dicha materia

- 1) **Análogos heterocíclicos del ciclopropano** azirinas, aziridina, oxirano, tilirano, diazireno y diazidirina, oxaziridina
- 2) **Análogos heterocíclicos de ciclobutano** azetidina, azetidinonas, oxeteno y oxetano, oxetanonas, tiete y tetano
- 3) **Anillos heterocíclicos de cuatro miembros con dos heteroátomos** dioxetano y ditiitanos
- 4) **Análogos heterocíclicos del ciclopentadieno con un heteroátomo** pirrol, furano, tiofeno
- 5) **Sistemas de anillos fusionados que incluyen a los anillos de pirrol, furano y tiofeno** indol, isoindol, indolizina y ciclazina, benzofurano, dibenzofurano, isobenzofurano, benzo[b]tiofeno, benzo[c]tiofeno

- 218
204
- 6) **Análogos heterocíclicos del bencen con un heteroátom** piridina, sales de pirilho, piranos, pironas
 - 7) **Análogos heterocíclicos del naftaleno con un heteroátomo** quinolina, isoquinolina, quinolizina, acridina y fenantndina, sales de benzopinlio y benzopiranos
 - 8) **Compuestos con dos heteroátomos en un anillo de cinco miembros** pirazol e imidazol, isoxazol y oxazol, isotiazol y tiazol, dioxol, dioxolano
 - 9) **Compuestos con dos heteroátomos en su anillo de seis miembros** pindazina, pinimidina, pirazinas, oxazinas y tiazinas, dioxanos
 - 10) **Compuestos con más de dos heteroátomos** purinas, pteridinas, triazinas, sidnonas, benzotriazoles
 - 11) **Compuestos heterocíclicos con anillos de siete o más miembros** borepina, azepina, diazepina, oxepina, tiepina
 - 12) **Heterocíclcos con anillos mayores** azocinas y azotinas

En consecuencia, se recomienda al interesado manejar un lenguaje químico específico de tal suerte que pueda determinarse el verdadero alcance de la invención reclamada porque tal como se presenta existe falta de claudad con respecto a la frontera que verdaderamente delimita si la invención es novedosa e inventiva frente a la materia comprendida en el estado de la técnica

- De igual forma se increpa al interesado para que evalúe el alcance de las connotaciones que señala para los radicales secundarios R_3 , R_4 , R_5 , R_6 , R_7 , R_8 , R_9 , R_{10} , R_{11} , R_{12} y R_{13} porque también se definen en atención a diversos grupos heterocíclicos que estructural, funcional y químicamente difieren unos de otros, generando de esta forma ambigüedad entorno a la idoneidad de las fórmulas markush (I), (Ia) y (II) tomadas como característica esencial de la invención

Para ello se remite al interesado a las cláusulas 2 a 14, 38 a 47 y 70 que presentan diversidad de radicales y grupos heterocíclicos que no sólo afectan la claridad y la suficiencia de la invención respecto al soporte relatado en el aparte descriptivo – aparte en el que no están descritos todas las modalidades extraíbles del uso de términos tan inespecíficos en los radicales como es el caso de "heterociclo" -, sino la unidad de invención que debe presentar la materia reclamada

Ahora bien, si se efectuaran las combinaciones de todas las posibles sustituciones contempladas a lo largo de las cláusulas 1 a 51 y 70 a 83 se obtendrían diversos compuestos que no encuentran representatividad única bajo el núcleo básico de las fórmulas (I), (Ia) o (II) dada la menor complejidad química que presentan las mismas

4. ES UNA INVENCION

El artículo 14 de la Decisión 486 contempla *"Los Países Miembros otorgarán patentes para las invenciones, sean de producto o de procedimiento, en todos los campos de la tecnología, siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial"*

La norma andina establece como objetos susceptibles de patentamiento aquellos que comprenden productos o procedimientos en todos los campos de la tecnología,

excluyendo de esta manera los USOS particulares de productos ya sea en el ámbito clínico o Industrial, es por ello que se recomienda al interesado eliminar del alcance de su invención aquellas cláusulas que hacen alusión al uso de los compuestos – reivindicaciones 91 a 104 –, porque en atención al artículo 14 de la Decisión 486 las mismas no constituyen materia susceptible de protección

5 EVALUACIÓN DE LA UNIDAD DE INVENCION

El art 25 de la decisión 486 establece que *"La solicitud de patente sólo podrá comprender una invención o grupo de invenciones relacionadas entre sí, de manera que conformen un único concepto inventivo"*

- Existe falta de un unico concepto inventivo que comprenda todas las modalidades posibles de la invención porque al estudiar las fórmulas (I), (Ia) y (II) y los significados químicos de los radicales primarios y de los secundarios se encuentra que es posible obtener más de un grupo de invenciones y que muchas de éstas, en atención a su complejidad química, no responden a los núcleos centrales que se señalan como características esenciales de la invención

Este hecho se confirma cuando en las cláusulas 1, 29, 48, 70 y 82 se señalan significados particulares para las fórmulas y se hace lo propio para los radicales primarios R₁, R₂, R , R , proyectándose connotaciones diversas que incluyen grupos heterocíclicos complejos de categoría química y funcional variada

Ahora bien, cuando se evalúan las connotaciones que toma R₁ en las fórmulas (I), (Ia) y (II) es posible evidenciar que existen cuatro posibilidades diferentes por cada una, es decir que son diversas las combinaciones posibles y por ende los conceptos inventivos que cobijan todos los compuestos reclamados, por esta razón se recomienda al interesado realizar las modificaciones correspondientes a fin de poder efectuar el examen de patentabilidad correspondiente y el estudio de la afectación ejercida por el estado de la técnica más cercano

- Es importante recalcar que las cláusulas 52 y 84 constituyen prueba suficiente de la falta de un unico concepto inventivo dada la diversidad estructural y química de los compuestos que allí se reclaman

6 EXCEPCIONES A LA PATENTABILIDAD

El artículo 20 en su literal (d) contempla *"No serán patentables los métodos terapéuticos o quirúrgicos para el tratamiento humano o animal, así como los métodos de diagnóstico aplicados a los seres humanos o a animales"*

Las cláusulas 55 a 68 que reclama un método para el tratamiento de enfermedades asociadas a la actividad catalítica de las proteasas cisteín-proteasa (cathepsina K o falcipaina) y serina-proteasa tal es el caso de aquellas caracterizadas por pérdida de masa ósea (como osteoporosis, periodontitis o gingivitis) el cual comprende inhibir dicha pérdida de masa ósea administrando una cantidad eficaz de un compuesto según las reivindicaciones 1 a 53 a un paciente que lo necesite y el método para tratar una enfermedad caracterizada por excesiva degradación de cartilago o matriz como osteoartritis o artritis reumatoide, que comprende inhibir dicha excesiva degradación de cartilago o matriz administrando una cantidad eficaz de un compuesto según las reivindicaciones 1 a 53 a un paciente que lo necesita, se encuentran contempladas dentro de las exclusiones legales a la patentabilidad, de acuerdo con el artículo 20 de la Decisión 486

Sucede lo propio con el método reclamado en la cláusula 67 para tratar una enfermedad caracterizada por infección con un parásito seleccionado del grupo formado por *Plasmodium falciparum*, *Trypanosoma cruzi*, *Trypanosoma brucei*, *Leishmania mexicana*, *Leishmania pifanoi*, *Leishmania major*, *Schistosoma mansoni*, *Onchocerca volvulus*, *Brugia pahangi*, *Entamoeba histolytica*, *Giardia lamblia*, los helmintos *Haemonchus contortus*, *Fasciola hepatica*, los hemitos de los géneros *Spirometra*, *Trichinella*, *Necator* y *Ascaris*, y protozoos de los géneros *Cryptosporidium*, *Elmeria*, *Toxoplasma* y *Naegleria* los cuales son causantes de enfermedades como malaria, tripanosomosis (tripanosomosis africana, enfermedad de Chagas) leishmaniasis, equistosomosis, oncocercosis y giardosis, método que comprende inhibir la expresión de una cisteína-proteasa causante de dicha enfermedad administrando una cantidad eficaz de un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 53 a un paciente que lo necesita, lo anterior porque el artículo 20 es expedito al afirmar que los métodos terapéuticos no son objeto de protección bajo la norma Andina

En consecuencia, se recomienda al interesado eliminar del alcance de su invención las cláusulas señaladas, teniendo en cuenta que no pueden ser objeto de protección por patente de invención

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 5 del título primero de la Circular Unica N° 10 de 2001

Álix Carmenza Céspedes de Vergel
Jefe de la División de Nuevas Creaciones

02 NOV 2006

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha _____

CONCEPTO TÉCNICO
Número 01703

EXAMINADOR TÉCNICO
Código 202044

~~2/11/006~~