

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

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
CARLOS R. OLARTE
office@olartemoure.com

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-126884- -00004-0000

Fecha: 2012-08-30 10:27:36 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 519 TRASLADOINFORME Folios: 8

ASUNTO	Radicación	09-126884	
	Trámite	011	
	Evento	378	
	Actuación	519	E15432
	Oficio		
	Folios	08	

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Vía Nacional	☐		
Vía PCT (fase nacional)	☒	Cap. I	☒ Cap. II ☐

No. Solicitud Internacional PCT/GB2008/050321
Fecha de Presentación Internacional 02/Mayo/2008

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 118 a 211	09/Noviembre/2009
Reivindicaciones:	Folios 212 a 220	09/Noviembre/2009
Prioridad:	US 60/916,270	04/Mayo/2007

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

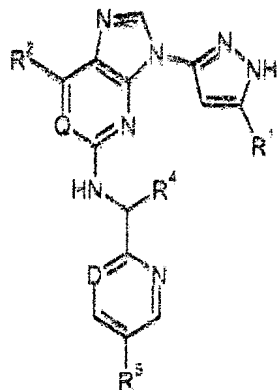
Título de la solicitud: "Derivados de 9-(pirazol-3-Il)-9H-purin-2-amina y 3-(pirazol-3-Il)-3H-imidazo [4,5-B] piridin-5-amina y su uso para el tratamiento del cáncer"

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar nuevos inhibidores de tirosin quinasa relacionados con tropomiosinas (Trk) para el tratamiento del cáncer.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona

Primer Artículo 45-Expediente 09 126884

compuestos de la fórmula (I) que poseen actividad inhibitoria de cinasa Trk y por lo tanto son útiles en el tratamiento del cáncer debido a su actividad antiproliferativa y proapoptótica.



Fórmula (I)

El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D471/04, C07D473/16, C07D473/18, C07D473/32, A61P35/00, A61K31/52.

4. Excepción a la Patentabilidad (Art 20 D486 literal d)

La reivindicación 10 está relacionada con un método de tratamiento, el cual no es patentable de acuerdo con el Art 20 literal d.

5. Reivindicaciones relativas a un uso (Art 14 D 486)

El uso de las reivindicaciones 8, 9, 11 y 12 no es patentable, de acuerdo con el Art 14. Aunque las reivindicaciones 8, 11 y 12 no están encabezadas por un uso, el contenido se refiere a un uso.

6. De la Solicitud de Patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

Las reivindicaciones 1 a 4 no son concisas, porque se encuentran definiciones de R1, R2, R3, R4 y R5 como heteroarilo, alquilocicloalquilo y cicloalquilo, los cuales corresponden a grupos funcionales, son ambiguos y no definen de manera inequívoca los sustituyentes de los compuestos reclamados. Por lo tanto se le sugiere al solicitante, en lo posible, restringir el capítulo reivindicatorio de la solicitud a una generalización razonable de las realizaciones preferidas. Adicionalmente se debe establecer el número de carbonos que los conforman, el número y tipo de heteroátomos.

En la definición de los radicales más representativos de la fórmula (I), de acuerdo con lo que se encuentra debidamente sustentado en el capítulo descriptivo, se encuentra que siempre varían entre los siguientes grupos funcionales y átomos:

Radical	Soporte en la descripción
R ¹	
R ²	CH3,
R ³	H
R ⁴	CH3, CH3CH2, CH3OH

R ⁵	F
Q	C, N
D	C, N

Por lo tanto se sugiere al solicitante presentar una generalización razonable y eliminar aquellas definiciones que exceden el sustento descriptivo.

7. Determinación del Estado de la Técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de prioridad (04/Mayo/2007) y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2006087530	chemical compounds	24/Agosto/2006
D2	WO2006087538	chemical compounds	24/Agosto/2006

D1<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2006087530A1&KC=A1&FT=D&ND=&date=20060824&DB=&locale=en> EP
Divulga derivados de pirazolpiridinas que poseen actividad inhibitoria de cinasa Trk para el tratamiento del cáncer (Pág. 2 a 4 y 81 a 85).

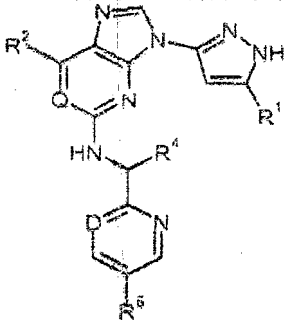
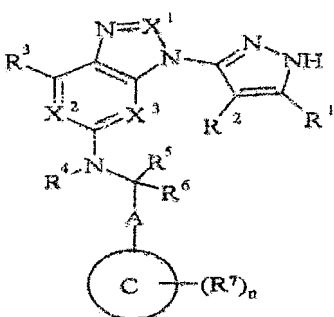
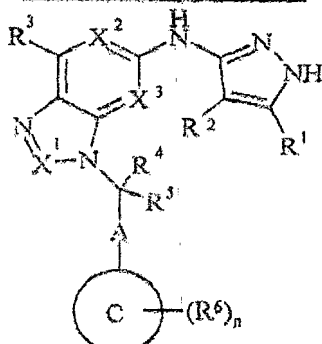
D2<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2006087538A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20060824&DB=EPODOC&locale=en> EP
Divulga derivados de pirazolpiridinas que poseen actividad inhibitoria de cinasa Trk para el tratamiento del cáncer (Pág. 2 a 4 y 60 a 65).

8. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en un compuesto de fórmula (I) o una sal farmacéuticamente aceptable donde: (Fl. 212 a 215)

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

Características esenciales	D1	D2
Compuesto de fórmula (I) 	Compuestos de fórmula 	Compuestos de fórmula 

	Anillo C = heterociclo de N y C	X1=C R4 y R5=H A=enlace C= heterociclo
R ¹ = alquilo, carbociclilo, OR donde R= alquilo	R ¹ = alquilo, carbociclilo	alcanoxi
R ² = H	R ² = H	R ² = H
R ³ = alquilo, -COH	R ³ = alquilo, alcoxi	R ³ = alquilo, alcoxi
R ⁴ = halo	R ⁴ = halo	R ⁴ = halo
Q = C, N	X ² = N, C	X3= C, N
D = C, N	X ² = N, C	C, N
Sal farmacéuticamente aceptable	Sal farmacéuticamente aceptable	Sal farmacéuticamente aceptable

Los documentos D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1.

D1 divulga derivados de pirazolpiridinas que poseen actividad inhibitoria de cinasa Trk para el tratamiento del cáncer (Pág. 2 a 4 y 81 a 85).

D2 derivados de pirazolpiridinas que poseen actividad inhibitoria de cinasa Trk para el tratamiento del cáncer (Pág. 2 a 4 y 61 a 65).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto de D1 consiste en que la invención tiene el grupo funcional alcanoxi en el radical equivalente a R1.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto de D2 consiste en que la invención tiene el grupo funcional amina secundario unido a el anillo pirimidina.

No se evidencia que por el hecho de tener el grupo funcional alcanoxi en el radical equivalente a R1, se tenga un efecto técnico inesperado.

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo modificar los compuestos de fórmula I conocidos en D1 para conseguir derivados de pirazolpirimidina alternativos".

Sin embargo, es conocido en el documento D2 el grupo funcional alcanoxi en el radical equivalente a R1.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, estaría motivada a emplear el grupo funcional alcanoxi en el radical equivalente a R1. Por lo cual se considera obvia.

Conclusión:

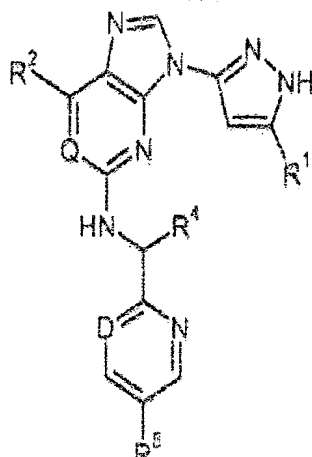
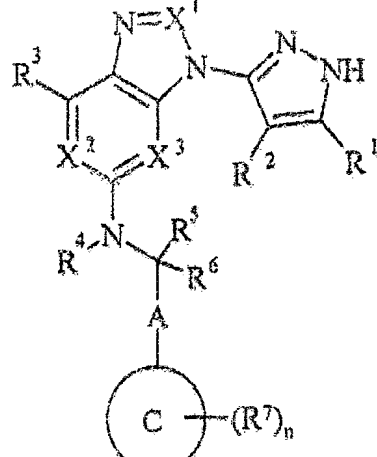
La reivindicación 1 no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 a 6 y 13 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

Novedad (Art 16 D486)

La reivindicación 7 consiste en un compuesto de fórmula (I) o una sal farmacéuticamente aceptable donde: (Fl. 217 a 218)

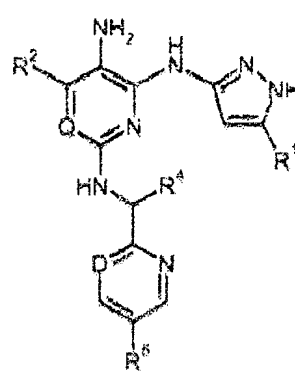
Comparación de las características técnicas esenciales, con las del Estado de la Técnica:

Características esenciales	D1
Compuesto de fórmula (I) 	Compuestos de fórmula  Anillo C = heterociclo de N y C
R ¹ = metilo, ciclopropilo, isopropoxi y etoxi	R ¹ = metilo, ciclopropilo, isopropoxi
R ² = H, metoxi, morfolin-4-ilo, tetrahidro-2H-piran-4-ilamino	R ² = H, metoxi
R ⁴ = metilo, etilo, hidroximetilo	R ⁶ = metilo, etilo, hidroximetilo
R ⁵ = F	R ⁷ = F
Q = C, N	X ² = N, C
D = C, N	X ³ = N, C
Sal farmacéuticamente aceptable	Sal farmacéuticamente aceptable

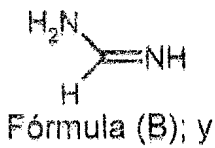
Las características técnicas esenciales del compuesto de fórmula (I) de la reivindicación 7 habían sido divulgadas previamente en D1, el cual da a conocer que R1= metilo, ciclopropilo y isopropoxi; R2= H, metoxi; R5= metilo, etilo, hidroximetilo; R7= F; X2= N, C y sus sales farmacéuticamente aceptables(Pág. 85) tal como se presenta en el cuadro anterior.

En consecuencia, la reivindicación 7 no es nueva, según lo divulgado en el documento D1.

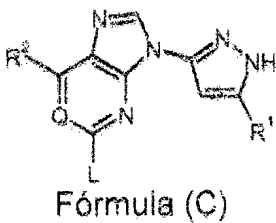
1) Proceso A: hacer reaccionar un compuesto de fórmula (A)



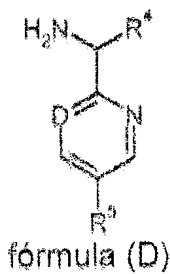
Con un compuesto de fórmula (B):



2) Proceso B: hacer reaccionar un compuesto de fórmula (C):



Con un compuesto de fórmula (D)

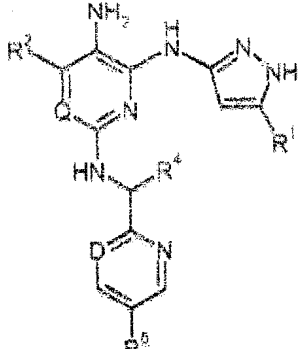
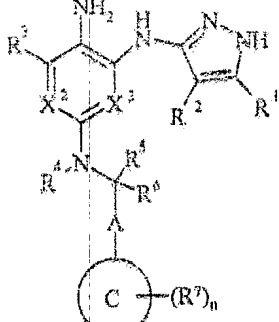
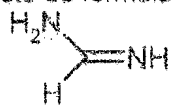
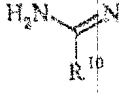


y posteriormente si fuese necesario:

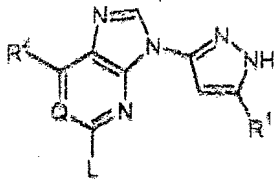
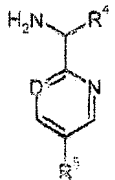
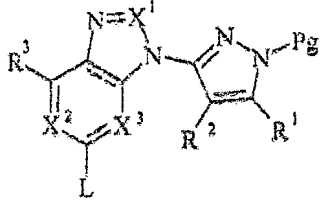
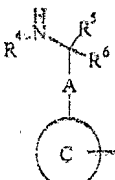
- i. convertir un compuesto de fórmula (I) en otro compuesto de fórmula (I);
- ii. eliminar cualquier grupo protector; y/o
- iii. formar una sal farmacéuticamente aceptable,

en la que cada vez que aparece L es el mismo o diferente y es un grupo saliente.

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

Características esenciales	D1
proceso A para preparar un compuesto de fórmula (I) que comprende	Proceso c) para preparar un compuesto de fórmula (I) que comprende
hacer reaccionar un compuesto de fórmula (A)	hacer reaccionar un compuesto de fórmula (V)
	
Con un compuesto de fórmula (B): 	Con un compuesto de fórmula (VI):  donde R10=H

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

Características esenciales	D1
proceso B para preparar un compuesto de fórmula (I) que comprende	Proceso e) para preparar un compuesto de fórmula (I) que comprende
hacer reaccionar un compuesto de fórmula (C)	hacer reaccionar un compuesto de fórmula (VII)
 L es un grupo saliente Con un compuesto de fórmula (D)  y posteriormente si fuese necesario: - convertir un compuesto de fórmula (I) en otro compuesto de fórmula (I); - eliminar cualquier grupo protector; y/o - formar una sal farmacéuticamente aceptable	 Pg es un nitrógeno protector y L es el grupo saliente Con un compuesto de fórmula (VIII)  y posteriormente si fuese necesario: - convertir un compuesto de fórmula (I) en otro compuesto de fórmula (I); - eliminar cualquier grupo protector; y/o - formar una sal farmacéuticamente aceptable

Las características técnicas esenciales de los procesos A y B para preparar un compuesto de fórmula (I) de la reivindicación 14 habían sido divulgadas previamente en D1, el cual da a conocer los procesos c) y e), tal como se presenta en el cuadro anterior. Asimismo, se definen el grupo saliente y las posteriores etapas opcionales para producir los compuestos de fórmula (I) de la reivindicación 1 a 7.

En consecuencia, la reivindicación 14 no es nueva, según lo divulgado en el documento D1.

9. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2006087530	1 a 6 y 13 7 y 14	Nivel inventivo Novedad
D2	WO2006087538	1 a 6 y 13	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.

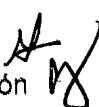
Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única No. 10 de 2001.



JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ
Director de Nuevas Creaciones (C)

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

04 SET. 2012

Elaborado por: Ruth Angélica Lizarazo Pedraza 
Revisado por: Consuelo Leguizamón Leguizamón 