Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

Prosperidad para todos

2020

| SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO | |
|---|---|
| **RAD:** 10-108096- -10 | **FECHA**: 2012-10-25 12:18:45 |
| **DEP:** 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES | **EVE:** 11 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I |
| **TRA:** 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II | **FOLIOS**: 2 |
| **ACT:** 519 PRESENTACION | |

## DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)
ULRIKE WEYER-CZERNILOFSKY
C/O BOEHRINGER INGELHEIM GMBH CD PATENTS BINGER STRASSE 173 55216

**Asunto**: Radicación: 10-108096- -10
Trámite: 11
Evento: 11
Actuación: 519
Oficio: 19365
Folios: 2

| | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|
| Patente de Invención | | | | Patente de Modelo de Utilidad | |
| Vía Nacional | | | | | |
| Vía PCT (Fase Nacional) | **X** | Capítulo I | **X** | Capítulo II | |
| No. Solicitud Internacional | | | | | |
| Fecha de Presentación Internacional | | | | | |

TEXT_

1. **Documentos estudiados**

| | | |
|---|---|---|
| Descripción: | Folios 176 a 333 | 01/Septiembre/2010 |
| Reivindicaciones: | Folios 334 a 337 | 01/Septiembre/2010 |
| Prioridad: | EP 0815271.0 | 13/Marzo/2008 |

**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: “Tiazolil-dihidro-indazoles, sus isómeros y procedimientos para su preparación” (modificado en el folio 349).

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar compuestos que actúan como inhibidores de cinasa de ciclo celular especificas, útiles en el tratamiento de enfermedades en las que involucran procesos de crecimiento celular diferenciación, control de cambios citoesqueléticos y regulación del transporte intracelular, y caracterizadas por una proliferación celular excesiva o anormal.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de la fórmula (I).

El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C 07 D513/004

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

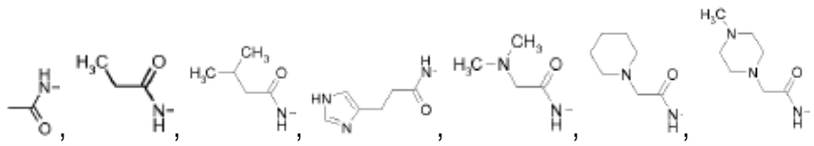
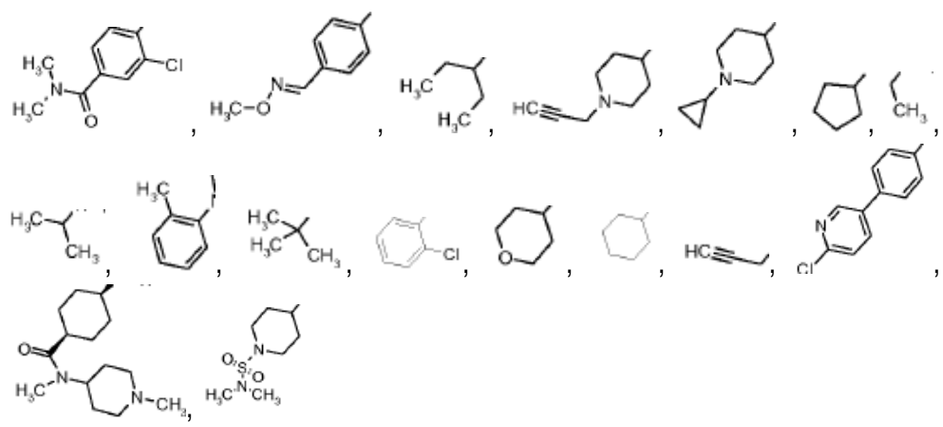
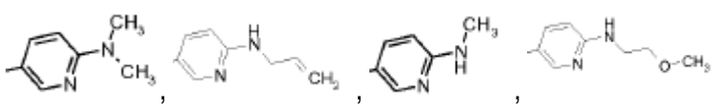
El uso de las reivindicaciones 7, 8, 10 no es patentable, de acuerdo con el Art 14.

## 5. De la Solicitud de Patente

### Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 no es clara ni concisa porque al definir la invención en términos de sustituyentes “heterocicloalquilo”, “arilo”, “heteroarilo”, entre otros, se involucran funcionales que no permiten distinguir la invención del estado de la técnica. Esto debido a que no se especifica el número de átomos de carbono que los conforman, en el caso de los anillos, ni el número y la clase de heteroátomos que los pueden llegar a conformar en el caso de los “hetero”, motivo por el cual se obtienen un sin número de compuestos que no encuentran soporte en la descripción.

La reivindicación 1 no es concisa, ni está sustentado en la descripción porque no hay suficientes ejemplos que demuestren que se hayan obtenido los compuestos con los sustituyentes tal como se encuentran allí definidos. Los compuestos obtenidos corresponden a los que comprenden preferiblemente los siguientes sustituyentes:

| Radical | Radical sustentado en la descripción |
|---|---|
| **R1** |  |
| **R2** |  |
| **R3** |  |

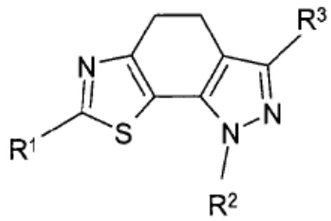
Se requiere al Solicitante hacer las aclaraciones necesarias y presentar una generalización razonable de lo que se encuentra sustentado.

## 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 13 de 2008, y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

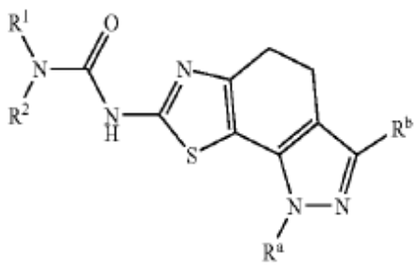
| Ítem | Documento | Título | Fecha de Publicación* |
|---|---|---|---|
| D1 | CA 2579288 | Thiazol-dyhidro indazole | 20/Abril/2006 |
| D2 | US 2007/0259855 | Thiazol-dyhidro indazole | 08/Noviembre/2007 |
| D3 | CA 2647278 | Thiazolyldihydroindazole derivatives as protein kinase inhibitors | 11/Octubre/2007 |

D1http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?FT=D&date=20060420&DB=EPODOC&locale=en_EP&CC=CA&NR=2579288A1&KC=A1&ND=2 divulga (Pág. 1) un compuesto de la fórmula (I).



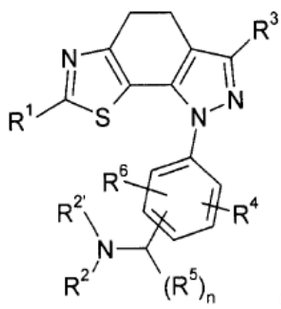
(I)

D2http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?FT=D&date=20071108&DB=&locale=en_EP&CC=US&NR=2007259855A1&KC=A1&ND=1
Divulga un compuesto de fórmula (I) (Párrafo 10)



(I)

D3http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?FT=D&date=20071011&DB=EPODOC&locale=en_EP&CC=CA&NR=2647278A1&KC=A1&ND=2 Divulga (Pág. 1) un compuesto de fórmula (1)

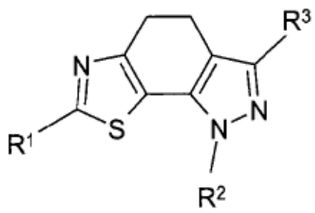


(1)

## 7. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

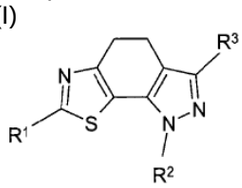
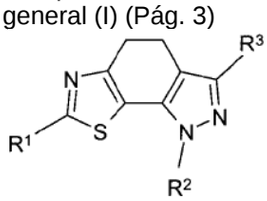
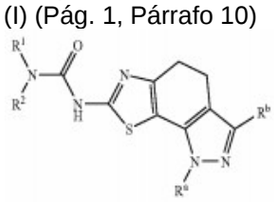
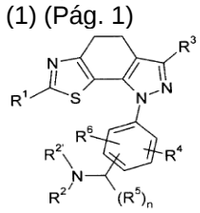
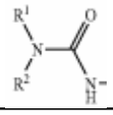
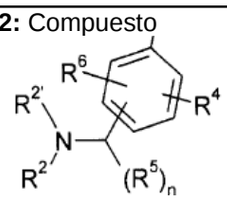
### Novedad (Art 16 D486)

La reivindicación 1 consiste en compuestos de fórmula general (I).



(I)

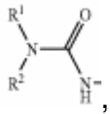
Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

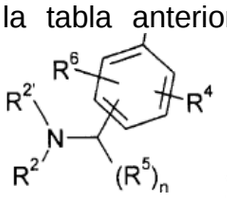
| Características **esenciales** | **D1** | **D2** | **D3** |
|---|---|---|---|
| Compuesto de fórmula (I)  (I) | Compuesto de fórmula general (I) (Pág. 3)  (I) | Compuesto de fórmula (I) (Pág. 1, Párrafo 10)  (I) | Compuesto de fórmula (1) (Pág. 1)  |
| **R1:**NHRc, NHC(O)R$^c$, NHC(O)OR$^c$, NHC(O)NR$^c$R$^c$, y NHC(O)SR$^c$. | **R1:**NHR$^c$, NHC(O)R$^c$, NHC(O)OR$^c$, NHC(O)NR$^c$R$^c$, y NHC(O)SR$^c$. (Pág. 3) | Compuesto  | **R1:** NHRa, NHC(O)Ra, NHC(O)Ora, NHC(O)NRaRa y NHC(O)SRa. (Pág. 1) |
| **R2:** H, alquilo C1-6, cicloalquilo C3-8, heterocicloalquilo de 3-8 miembros, arilo C6-10, arilalquilo heterocicloalquilo de 3-8 miembros y heteroarilo de 5 – 10 miembros, opcionalmente sustituido con R4 | **R2:** Alquilo C1-6, cicloalquilo C3-8, heterocicloalquilo de 3-8 miembros, arilo C6-10 y heteroarilo de 5 – 10 miembros, opcionalmente sustituido con R4. (Pág. 3 – 4) | **Ra:** H, o un grupo opcionalmente sustituido seleccionado de alquilo C1-8, cicloalquilo C3-8, heterocicloalquilo C3-8, arilo C6-14. (Pág 1, Párrafo 11) | **R2:** Compuesto  |
| **R3:** Heteroarilo de 6 miembros, sustituido con uno o más Ra y/o Rb idénticos o diferentes. Heteroarilo de 8 – 10 miembros, opcionalmente sustituido con uno o mas Re y/o Rf, idénticos o diferentes. | **R3:** Arilo C6-10, heteroarilo 5-10 miembros opcionalmente sustituido con uno o mas Re y/o Rf. (pág 4) | **Rb:** Heteroarilo C6-10. (Pág 1, Párrafo 12) | **R3:** Arilo C6-10, heteroarilo de 5 -6 miembros opcionalmente sustituidos. (Pág. 1) |

Las características **esenciales** del compuesto de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en D1, el cual da a conocer un compuesto de fórmula (I) el cual presenta en su estructura tiazolil-dihidro-indazoles sustituidos con los radicales R1, R2 y R3, los cuales corresponden a los compuestos mencionados en la tabla anterior. (Pág. 3 – 4).

El documento D1 divulga específicamente los siguientes sustituyentes:
R3: es seleccionado de un grupo que comprende piridilo, pirimidilo y piridazinilo, en donde el compuesto preferido es piridilo.

R1: es –NHC(O)$R^c$, específicamente el compuesto NHC(O)$CH_3$

Por su parte, el documento D2 da a conocer un compuesto de fórmula (I), el cual presenta en su estructura tiazolil-dihidro-indazoles sustituidos en el anillo tiazol con el grupo  , y en el anillo indazol con los sustituyentes Ra y Rb, los cuales corresponden a Ra a un átomo de hidrógeno, o un grupo opcionalmente sustituido seleccionado de alquilo C1-8, cicloalquilo C3-8, heterocicloalquilo C3-8, arilo C6-14 y Rb a heteroarilo C6-10 opcionalmente sustituido. (Párrafo 10 – 15)

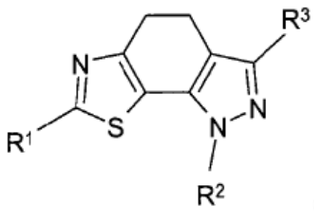
De igual manera, el documento D3 divulga el compuesto de fórmula (1), el cual presenta una estructura tiazolil-dihidro-indazol sustituido con R1, el cual presenta total correspondencia estructural con los compuestos nombrados en la tabla anterior porque en el anillo indazol está sustituido por el anillo  y por R3 el cual corresponde a arilo C6-10, heteroarilo de 5 -6 miembros opcionalmente sustituido. (Pág. 2)

En consecuencia, la reivindicación 1 carece de novedad, según lo divulgado de manera independiente en cada uno de los documentos D1, D2 y D3.

Las reivindicaciones dependientes 2 – 11 no mencionan alguna característica que haga nuevos los compuestos de fórmula (I) de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.

**Nivel Inventivo (Art18 D486)**

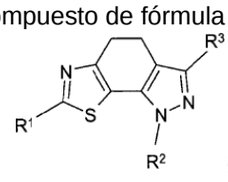
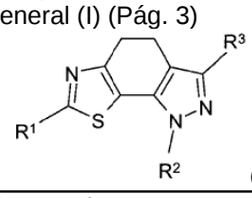
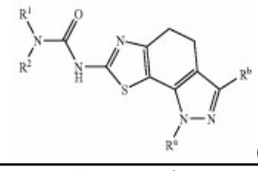
La reivindicación 1 consiste en compuestos de fórmula general (I).



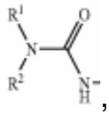
(I)

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

| Características **esenciales** | **D1** | **D2** |
|---|---|---|

| Compuesto de fórmula (I)  | Compuesto de fórmula general (I) (Pág. 3)  | Compuesto de fórmula (I) (Pág. 1, Párrafo 10)  |
|---|---|---|
| **R1:**NHC(O)N(Rg)ORc | No menciona | No menciona |
| **R2:** H, alquilo C1-6, cicloalquilo C3-8, heterocicloalquilo de 3-8 miembros, arilo C6-10, arilalquilo heterocicloalquilo de 3-8 miembros y heteroarilo de 5 – 10 miembros, opcionalmente sustituido con R4 | **R2:** Alquilo C1-6, cicloalquilo C3-8, heterocicloalquilo de 3-8 miembros, arilo C6-10 y heteroarilo de 5 – 10 miembros, opcionalmente sustituido con R4. (Pág. 3) | **Ra:** H, o un grupo opcionalmente sustituido seleccionado de alquilo C1-8, cicloalquilo C3-8, heterocicloalquilo C3-8, arilo C6-14. (Pág 1, Párrafo 11) |
| **R3:** Heteroarilo de 6 miembros, sustituido con uno o más Ra y/o Rb idénticos o diferentes. Heteroarilo de 8 – 10 miembros, opcionalmente sustituido con uno o mas Re y/o Rf, idénticos o diferentes. | **R3:** Arilo C6-10, heteroarilo 5-10 miembros opcionalmente sustituido con uno o mas Re y/o Rf. (Pág. 4) | **Rb:** Heteroarilo C6-10. (Pág 1, Párrafo 12) |

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

El documento D1 da a conocer compuestos útiles para el tratamiento de enfermedades caracterizadas por excesivo o anómalo crecimiento células. Éstos compuestos de fórmula (I) presentan en su estructura tiazolil-dihidro-indazoles sustituidos con los radicales R1, R2 y R3, los cuales corresponden a los compuestos mencionados en la tabla anterior (Pág. 3 – 4).Adicionalmente el documento D1 divulga específicamente los siguientes sustituyentes:
R3: es seleccionado de un grupo que comprende piridilo, pirimidilo y piridazinilo, en donde el compuesto preferido es piridilo.
R1: es –NHC(O)$R^c$, específicamente el compuesto NHC(O)$CH_3$
Por su parte, el documento D2 divulga compuestos inhibidores de fosfatidilinositol-3-cinasas (PI3-cinasas), de fórmula (I) que presentan en su estructura anillos de tiazolil-dihidro-indazoles sustituidos, en donde el anillo tiazol se sustituye con el grupo  , y el anillo indazol con los sustituyentes Ra y Rb, los cuales corresponden a: Ra a un átomo de hidrógeno, o un grupo opcionalmente sustituido seleccionado de alquilo C1-8, cicloalquilo C3-8, heterocicloalquilo C3-8, arilo C6-14 y Rb a heteroarilo C6-10 opcionalmente sustituido. (Párrafo 10 – 15)

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y los

compuestos divulgados en los documentos D1 y el documento D2 consisten en la presencia del sustituyente R1: básicamente el grupo NHC(O)N(Rg)ORc sobre el anillo de tiazol.

El hecho de incluir el grupo NHC(O)N(Rg)ORc como sustituyente sobre el anillo tiazolil no evidencia algún efecto técnico inesperado o sorprendente asociado a la actividad sobre las cinasas de ciclo celular específicas, que hagan diferente a la actividad de la estructura tiazolil-dihidro-indazoles conocida en el estado de la técnica y divulgada en D1 y D2.

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 los documentos D1 y D2 para obtener compuestos alternativos útiles para le tratamiento de enfermedades asociadas a la actividad de cinasas de ciclo celular específicas, y caracterizadas por una proliferación celular excesiva o anormal".

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, esperaría obtener compuestos que presenten actividad inhibidores de cinasa de ciclo celular específicas, a partir de los compuestos conocidos en los documentos D1 y D2 y llegar así a resolver el mismo problema técnico. Por lo cual se considera obvia.

En conclusión, la reivindicación 1 no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

## 8. Conclusión

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

| Ítem | Documento | Reivindicaciones afectadas | Requisito que afecta |
|---|---|---|---|
| D1 | CA 2579288 | 1 – 11 | Novedad<br>Nivel Inventivo |
| D2 | US 2007/0259855 | 1 – 11 | Novedad<br>Nivel Inventivo |
| D3 | CA 2647278 | 1 - 11 | Novedad |

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 2012-10-30

Elaboró: Gina Paola Duarte Beltran
Revisó: Consuelo Leguizamon Leguizamon
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez