

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 10-153711- -7	FECHA: 2013-01-17 09:24:06
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 9
ACT: 519 PRESENTACION	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
CARLOS REYNALDO OLARTE GARCIA
office@olartemoure.com

Asunto: Radicación: 10-153711- -7
Trámite: 11
Evento: 378
Actuación: 519
Oficio: 461
Folios: 9

Patente de Invención	X			Patente de Modelo de Utilidad	
Vía Nacional					
Vía PCT (Fase Nacional)	X	Capítulo I	X	Capítulo II	
No. Solicitud Internacional	PCT/US2009/043073				
Fecha de Presentación Internacional	07/05/2009				

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:

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 145 a 413	06 de diciembre de 2010
Reivindicaciones:	Folios 414 a 446	06 de diciembre de 2010
	Folios 519 a 556	13 de enero de 2012
Prioridad:	US 61/052.879	13 de mayo de 2008
	US 61/152.872	16 de febrero de 2009

2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de prioridad porque ésta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

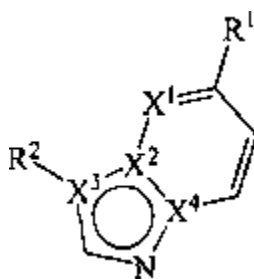
3. Objeto de la invención

De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del capítulo primero del Título 10 de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por el solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es que cuando la solicitud contenga más de diez (10) reivindicaciones y no se haya pagado la tasa complementaria, sólo se estudiarán las cubiertas por la tasa pagada. En el presente caso el solicitante canceló la tasa correspondiente a la modificación del capítulo reivindicatorio y la tasa de las reivindicaciones adicionales (Fls 517 y 518) por tanto se procede al examen del capítulo reivindicatorio de los folios 5519 a 556.

Título de la solicitud: “compuestos heterocíclicos que contienen átomos como únicos hetero átomos en el anillo en el sistema orto- condensado y composiciones de los mismos, útiles como inhibidores de cinasa.” (modificado Fl. 460).

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de diseñar, compuestos útiles como inhibidores de cinasa (PK).

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de la fórmula (I) derivados de imidazo[1,2-*b*]piridazina y 3*H*-imidazo[4,5-*b*]piridina



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 471/04, C07D 487/04, A61K 31/4985, A61K 31/5353 A61P 37/00.

4. De la solicitud de patente

Título

El título es muy general y no permite comprender cuál es el objeto de la solicitud: por lo tanto se sugiere al solicitante cambiarlo por: “derivados de derivados de imidazo[1,2-*b*]piridazina y 3*H*-imidazo[4,5-*b*]piridina, composiciones de los mismos como inhibidores de cinasa.”

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

Las reivindicaciones 1, 4 a 14 y 17 no son claras ni concisas cuanto utilizan términos tales como:

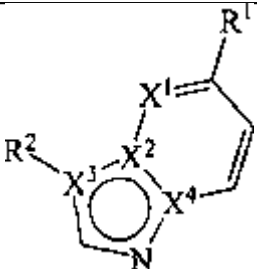
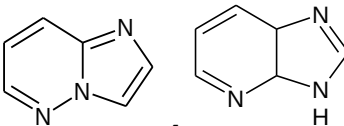
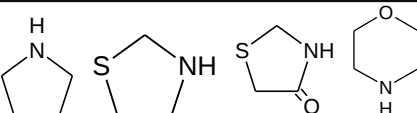
- Alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, Alquilo de 1 a 8 átomos de carbono sustituido por halógeno, alcoxilo de 1 a 8 tomos de carbono, hidroxi-alquilo de 1

a 8 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 8 tomos de carbono sustituido por halógeno, amino-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 8 átomos de carbono, alquileno de 2 a 8 átomos de carbono, alcoxileno de 1 a 8 átomos de carbono: porque dan lugar a un amplio número sustituyentes que no se encuentran soportados en la descripción.

- Arilo de 6 a 14 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, arileno de 6 a 14 átomos de carbono, cicloalquileno de 3 a 8 átomos de carbono: porque dan lugar a un amplio número sustituyentes que no se encuentran soportados en la descripción.
- Heterocicloalquilo de 2 a 14 átomos de carbono y heteroarilo de 2 a 13 átomos de carbono, heteroarileno de 2 a 13 átomos de carbono, hetero-cicloalquileno de 2 a 14 átomos de carbono: porque no definen el número y tipo de heteroátomos que contiene el heterociclo, dando lugar a un amplio número sustituyentes que no se encuentran soportados en la descripción.
- “Están opcionalmente sustituidos”: porque no define claramente la materia que se desea proteger, porque no establece los casos en los cuales la característica aparece, por lo tanto, se sugiere al solicitante definir la materia a proteger de una manera más precisa.
- P es independientemente de 1, 2, 3, 4, 5 ó 6 porque da lugar a un amplio número de alternativas que no se encuentran soportadas en la descripción.
- La reivindicación 1 especifica la formación de solvatos de los compuestos reivindicados, lo cual es falta de claridad debido a que para determinar si un sustrato particular formaría solvatos o hidratos requeriría la síntesis del sustrato y someterlo a recristalización con una variedad de solventes, temperaturas y humedades y en el capítulo descriptivo no hay un ejemplo de trabajo de cualquier hidrato o solvato formado. Y no hay evidencia de que tales compuestos existan. Por lo que se sugiere eliminar este término del capítulo reivindicatorio.

Dado lo anterior, se obtiene una innumerable combinación de compuestos que no encuentran soporte en la descripción, se sugiere restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que ha sido sintetizado o probado, es decir, que se encuentran debidamente sustentados.

Para tal efecto, esta Oficina manifiesta que en la descripción se encuentran soportados los siguientes compuestos a los cuales el solicitante puede tener en cuenta para la respectiva restricción

	
X ¹ -X ⁴	
R ¹	
R ²	Benzonitrilo, fenilimidazol, feniltetrazol, 4-(piridin-2-il)morfolin, 1-(piridin-2-il)piperazin, 2-(piperazin-1-

	il)benzonitrilo, 2-(4-acetilpiperazin-1-il)benzonitrilo, 1-(piridin-2-il)piperidin-4-ol, 2,6-dimetil-4-(piridin-2-il)morfolin, 2-(piperidin-4-iloxi)piridin, 4-(piridin-2-ilmetil)morfolin, 2-[(4-metilpiperazin-1-il)metil]benzonitrilo, [1-(piridin-2-il)piperidin-4-il]metanol, [1-(piridin-2-il)piperidin-4-il] etanol, 1-(piridin-2-il)piperidin-3-carboxamida, piridin-2-carboxílico, piridin-2-carbonitrilo, 1H-indol, 1-metil-1H-indol, 2-(pirrolidin-1-il)pirazin, 2-(4-metilpiperazin-1-il)pirazin, 1-(1,3-tiazol-2-il)piperidin, 2-cloropirazin, N,N-dimethylpyrazin-2-amine, 1H-indazol, N-metilpiridin-2-carboxamida, piridin-2-carboxamida,
R ³	Fluorofenilo, difluorofenilo, dimetilfenilo,

La reivindicación 22 consiste en una composición farmacéutica para administración intravenosa, administración oral, administración rectal, inhalación, administración nasal, administración tópica, administración oftálmica, o administración ótica, no es clara puesto que no se define en virtud de sus componentes y proporciones. Al no tener otra característica esencial, se sugiere al solicitante eliminarla del capítulo reivindicatorio.

La reivindicación 23 consiste en una composición farmacéutica en donde la composición farmacéutica es una tableta, una píldora, una cápsula, un líquido, un inhalante, una solución dc aspersion nasal, un supositorio, una solución, una emulsión, un ungüento, gotas para los ojos, o gotas para los oídos, no es clara puesto que no se define en virtud de sus componentes y proporciones. Al no tener otra característica esencial, se sugiere al solicitante eliminarla del capítulo reivindicatorio.

5. 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: 13 de mayo de 2008 se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	WO2008030579	“Modulators Of- Interleukin-1 Receptor-Associated Kinase”	13 de marzo de 2008
D2	WO0100213	“SRC Kinase Inhibitor Compounds”	04 de enero de 2001

El documento D1^[1] La presente invención se refiere a moduladores de quinasa IRAK y proporciona composiciones que comprenden tales moduladores, así como los métodos con los mismos para el tratamiento de condiciones o enfermedades mediadas y asociadas con la IRAK quinasa.

El documento D2^[2] divulga compuestos de pirimidina (Fórmula I), o sus sales farmacéuticamente aceptables, hidratos, solvatos, formas cristalinas y diastereómeros individuales, y las composiciones farmacéuticas que incluyen la misma, que son inhibidores de las enzimas de tirosina quinasa, y como tales son útiles en la profilaxis y tratamiento de la proteína tirosina quinasa asociada a trastornos, tales como enfermedades inmunes, trastornos hiperproliferativos y otras enfermedades en las que se cree que la acción inapropiada de la proteína quinasa juegan un papel, como el cáncer, la angiogénesis, la aterosclerosis, rechazo de injerto, artritis reumatoide y psoriasis.

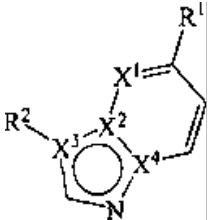
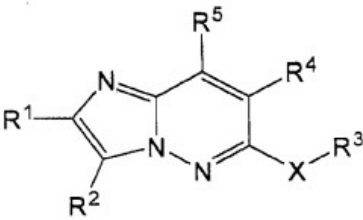
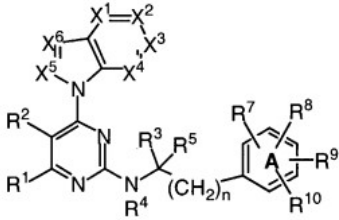
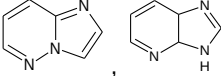
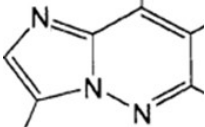
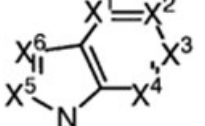
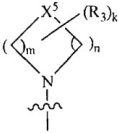
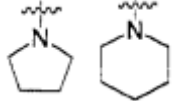
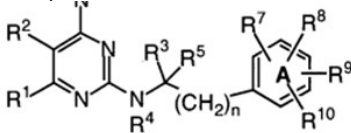
6. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

La reivindicación 1 consiste en un compuesto de fórmula (I).

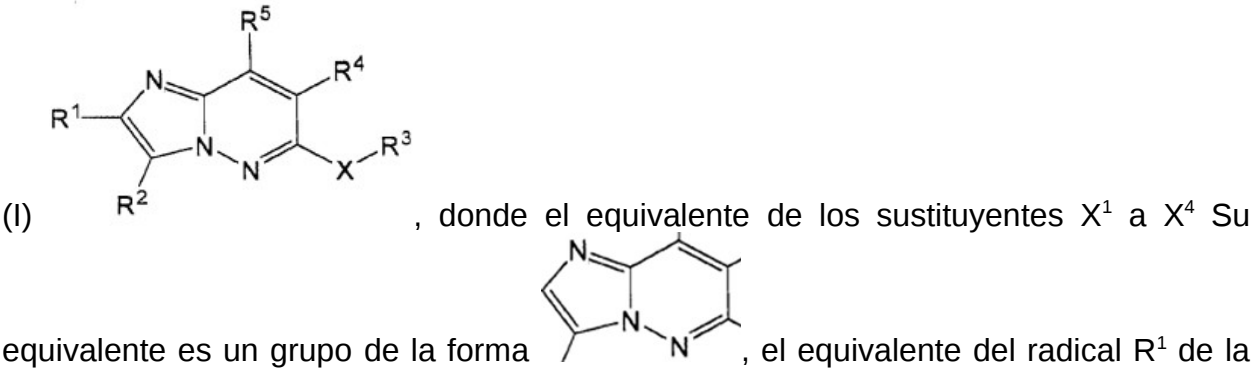
Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

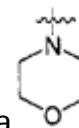
[1] URL: http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20080313&CC=WO&NR=2008030579A2&KC=A2
 [2] URL: http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=0100213&KC=&FT=E&locale=en_EP

Características esenciales	D1	D2
Un compuesto de fórmula (I)	Un compuesto de fórmula (I)	Un compuesto de fórmula (Ib)
		
X ¹ a X ⁴ es 	Su equivalente es un grupo de la forma 	El equivalente de X ¹⁻⁴ -X ¹ -X ² -X ³ -X ⁴ -is: h) -CR ⁶ =CR ⁶ -CR ⁶ =N ⁻ , 
R ¹ es un grupo de la forma 	Sus equivalente el grupo X-R ³ que  consiste  (párrafo 23)	El equivalente de R ¹ es R ⁶ el cual consiste de H, halo (Br, Cl, I o F), OH, SH, CN, O, NO ₂ , N ₃ , N ₂ +BF ₄ ⁻ , R ¹¹ , OR ¹¹ , OC(=O)R ¹¹ , OC(=O)NHR ¹¹ .
R ² arilo C ₆₋₁₄ , heteroarilo C ₂₋₁₃ , heterocicloalquilo C ₂₋₁₄ , arilo C ₆₋₁₄ , heteroarilo C ₂₋₁₃ , heterocicloalquilo C ₂₋₁₄ , opcionalmente sustituidos con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente a partir de halogeno, heterocicloalquilo C ₂₋₁₄ , heteroarilo C ₂₋₁₃ , alquilo C ₁₋₈ , cicloalquilo C ₃₋₈ , -CN, -C(O)N(R ⁴) ₂ , -N(R ⁴)C(O)OR ⁴ , -N(R ⁴)C(O)R ⁴ , -C(O)R ⁴ , -OR ⁹ , -C(O)OR ⁹ , -N(R ⁴) ₂ , -R ⁶ , -OR ⁶ , -	R ² es fenilo o naftilo, los cuales están sustituidos con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en halo, ciano, nitro, hidroxilo, alcoxi, alcoxi-alcoxi, haloalcoxi, haloalquilo, alquilsulfanilo, alquilo, alqueno, alquino, sililalkenil, alquilcarbonilalquilo, y carboxi. el sustituyente alquilo o el resto alquilo de estos sustituyentes opcionales pueden contener de 1 a 12 (por ejemplo, 1 a 6 o de 1 a 4) átomos de carbono. (párrafo 23), R ² es pirimidinilo, piridinilo, indolilo, tiofenilo, quinoxalinil, benzooxadiazol, pirrolilo, triazolilo, tetrazolilo, indazolilo, benzofuranilo, dihidrobenzo-oxazina, furanil, benzotiofenilo, quinolinilo, o pirazolilo, hidrocarbonilo), hidroxi alquilo, o alcoxi alquilo. (párrafo 33)	El equivalente de R ² es 

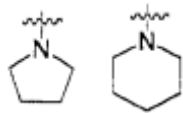
Novedad frente a D1

Las características esenciales de la composición de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en el documento D1, el cual divulga un compuesto de fórmula





actual solicitud es el grupo $X-R^3$ que consiste entre otros en grupos de la forma



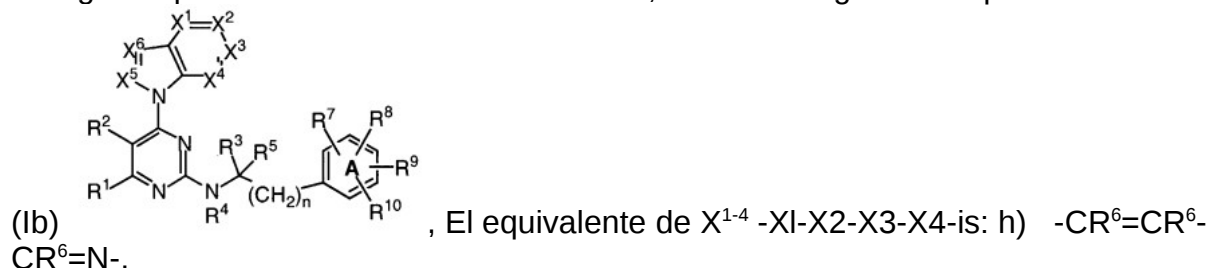
(párrafo 23), el equivalente del radical R^2 es el radical R^2 es fenilo o naftilo, los cuales están sustituidos con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en halo, ciano, nitro, hidroxilo, alcoxi, alcoxi-alcoxi, haloalcoxi, haloalquilo, alquilsulfanilo, alquilo, alqueno, alquino, sililalkenil, alquilcarbonilalquilo, y carboxi. el sustituyente alquilo o el resto alquilo de estos sustituyentes opcionales pueden contener de 1 a 12 (por ejemplo, 1 a 6 o de 1 a 4) átomos de carbono. (párrafo 23), R^2 es pirimidinilo, piridinilo, indolilo, tiofenilo, quinoxalinil, benzoaxadiazol, pirrolilo, triazolilo, tetrazolilo, indazolilo, benzofuranilo, dihidrobenzo-oxazina, furanil, benzotiofenilo, quinolinilo, o pirazolilo, hidrocarbonilo), hidroxialquilo, o alcoxialquilo. (párrafo 33).

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

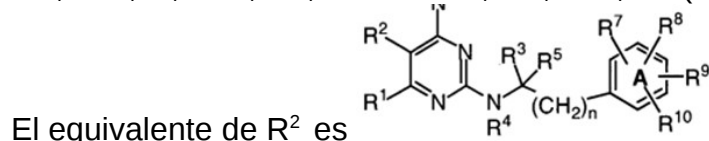
Las reivindicaciones dependientes 2 a 19 y 20 a 23 no mencionan alguna característica que haga nueva a la composición de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.

Novedad frente a D2

Las características esenciales de la composición de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en el documento D2, el cual divulga un compuesto de fórmula



, El equivalente de R^1 es R^6 el cual consiste de H, halo (Br, Cl, I o F), OH, SH, CN, O, NO₂, N₃, N₂+BF₄⁻, R¹¹, OR¹¹, OC(=O)R¹¹, OC(=O)OR¹¹, OC(=O)NHR¹¹..

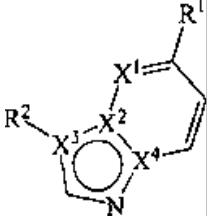
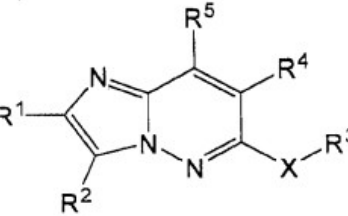
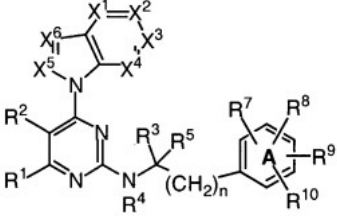
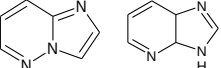
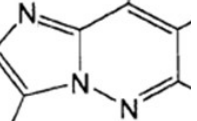
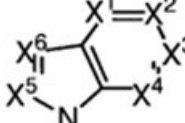
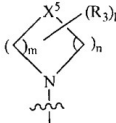
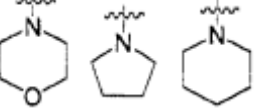
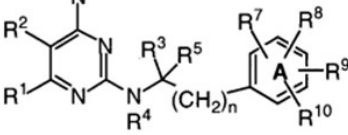


En consecuencia, la reivindicación 1 no es nueva o carece de novedad, según lo divulgado en el documento D2.

Las reivindicaciones dependientes 2 a 19 y 20 a 23 no mencionan alguna característica que haga nueva a la composición de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.

Nivel inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en un compuesto de fórmula (I).

Características esenciales	D1	D2
Un compuesto de fórmula (I)	Un compuesto de fórmula (I)	Un compuesto de fórmula (Ib)
		
X ¹ a X ⁴ es 	Su equivalente es un grupo de la forma 	El equivalente de X ¹⁻⁴ -X ¹ -X ² -X ³ -X ⁴ -is: h) -CR ⁶ =CR ⁶ -CR ⁶ =N-, 
R ¹ es un grupo de la forma 	Sus equivalente el grupo X-R ³ que consiste 	El equivalente de R ¹ es R ⁶ el cual consiste de H, halo (Br, Cl, I o F), OH, SH, CN, O, NO ₂ , N ₃ , N ₂ +BF ₄ ⁻ , R ¹¹ , OR ¹¹ , OC(=O)R ¹¹ , OC(=O)OR ¹¹ , OC(=O)NHR ¹¹ .
R ² arilo C ₆₋₁₄ , heteroarilo C ₂₋₁₃ , heterocicloalquilo C ₂₋₁₄ , arilo C ₆₋₁₄ , heteroarilo C ₂₋₁₃ , heterocicloalquilo C ₂₋₁₄ , opcionalmente sustituidos con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente a partir de halogeno, heterocicloalquilo C ₂₋₁₄ , heteroarilo C ₂₋₁₃ , alquilo C ₁₋₈ , cicloalquilo C ₃₋₈ , -CN, -C(O)N(R ⁴) ₂ , -N(R ⁴)C(O)OR ⁴ , -N(R ⁴)C(O)R ⁴ , -C(O)R ⁴ , -OR ⁹ , -C(O)OR ⁹ , -N(R ⁴) ₂ , -R ⁶ , -OR ⁶ , -	R ² es fenilo o naftilo, los cuales están sustituidos con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en halo, ciano, nitro, hidroxilo, alcoxi, alcoxi-alcoxi, haloalcoxi, haloalquilo, alquilsulfanilo, alquilo, alquenoilo, alquinoilo, sililalkenil, alquilcarbonilalquilo, y carboxi. el sustituyente alquilo o el resto alquilo de estos sustituyentes opcionales pueden contener de 1 a 12 (por ejemplo, 1 a 6 o de 1 a 4) átomos de carbono. (párrafo 23), R ² es pirimidinilo, piridinilo, indolilo, tiofenilo, quinoxalilil, benzooxadiazol, pirrolilo, triazolilo, tetrazolilo, indazolilo, benzofuranilo, dihidrobenzo-oxazina, furanil, benzotiofenilo, quinolinilo, o pirazolilo, hidrocarbonilo), hidroxialquilo, o alcoxialquilo. (párrafo 33)	El equivalente de R ² es 

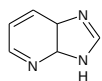
R1c1nc(R2)c2nc(R3)c(R4)c(R5)n12

equivalente es un grupo de la forma

1er Art 45

sustituidos con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en halo, ciano, nitro, hidroxilo, alcoxi, alcoxi-alcoxi, haloalcoxi, haloalquilo, alquilsulfanilo, alquilo, alqueno, alquino, sililalkenil, alquilcarbonilalquilo, y carboxi. el sustituyente alquilo o el resto alquilo de estos sustituyentes opcionales pueden contener de 1 a 12 (por ejemplo, 1 a 6 o de 1 a 4) átomos de carbono. (párrafo 23), R² es pirimidinilo, piridinilo, indolilo, tiofenilo, quinoxalinil, benzooxadiazol, pirrolilo, triazolilo, tetrazolilo, indazolilo, benzofuranilo, dihidrobenzo-oxazina, furanil, benzotiofenilo, quinolinilo, o pirazolilo, hidrocarbonilo), hidroxialquilo, o alcoxialquilo. (párrafo 33)

El efecto técnico que logra la diferencia, consiste en que se obtienen compuestos de fórmula I que incluyen dentro de sus realizaciones un anillo 3H-imidazo[4,5-b]piridina



, pero no se evidencia en la solicitud un trabajo comparativo entre los compuestos de fórmula (I) de la actual solicitud y los compuestos de fórmula (I) de D1 que demuestren un efecto técnico respecto de la técnica anterior.

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo presentar compuestos alternativos de fórmula (I) a los conocidos en D1 que incluyan un grupo 3H-imidazo[4,5-b]piridina”.

Sin embargo, la utilización de un grupo 3H-imidazo[4,5-b]piridina para obtener compuestos con actividad inhibitoria quinasa fue divulgada con anterioridad en D2 (Resumen).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría un grupo 3H-imidazo[4,5-b]piridina como se sugiere en el documento D2 en la obtención de los compuestos del documento D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Conclusión:

La reivindicación 1 cumple el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

Las reivindicaciones dependientes 2 a 23 no mencionan alguna característica que haga inventivo al compuesto de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son inventivas.

7. Conclusión

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

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2008030579	1 a 19 y 21 a 23	Novedad
		1 a 23	Nivel inventivo
D2	WO0100213	1 a 23	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.

Finalmente, se le recuerda al solicitante que si como respuesta a este requerimiento llegara a modificar el capítulo reivindicatorio y éste contenga más de diez (10) reivindicaciones, no pagará la tasa de modificación voluntaria pero sí la correspondiente al pago por reivindicación adicional.

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 2013-01-22

Elaboró: Harvey Alonso Jaramillo
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Roza
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez