

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogada
Margarita Castellanos Abonando
info@castellanosyco.co

ASUNTO	Radicación	10 154 098
	Trámite	011
	Evento	378
	Actuación	519
	Oficio	007
	Folios	17 4 1 9

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Vía Nacional			
Vía PCT (Fase Nacional)	☒	Capítulo I	☒
No. Solicitud Internacional	PCT/JP09/060696		
Fecha de Presentación Internacional	11/Junio/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:

1. Documentos estudiados

Descripción:	Folios 181 a 363	07/Diciembre/2010
Reivindicaciones:	Folios 364 a 369	07/Diciembre/2010
Prioridad:	JP 2008-154990	13/Junio/2008
	JP 2008-271689	22/Octubre/2008
	JP 2009-103616	22/abril/2009

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

Expediente 10-154098 1er Art 45

Título de la solicitud: "DERIVADOS HETEROCICLICOS QUE CONTIENEN AZUFRE QUE TIENEN ACTIVIDAD INHIBITORIA DE LA BETA SECRETASA"

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar compuestos con actividad como inhibidores de la producción β amiloide para tratar enfermedades inducida por la producción, secreción y/o depositación de la proteína β amiloide.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de la fórmula (I), (II), (III), (IV) y la composición que los contiene.

El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 417/12//417/10//, 417/14//; A61K 31/4439//31/497//31/541; A61P 25/28//43/00.

4. Excepción a la Patentabilidad (Art 20 D 486 literal (d))

El objeto de las reivindicaciones 17 no es patentable de acuerdo con el Art citado.

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

El uso de las reivindicaciones 18 no es patentable, de acuerdo con el Art 14.

Aunque la reivindicación 19 esta encabezada como un compuesto, el objeto de la misma se refiere a un uso, por lo tanto no es patentable de acuerdo con el Art citado.

6. De la Solicitud de Patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 y sus dependientes no son concisas porque las definiciones de A grupo "carbocíclico", "heterocíclico", R1, R2a y R2b, R3a y R3c las cuales son "alquilo más bajo", "alquileo más bajo", "opcionalmente sustituido", "aril alquilo más bajo", "carbocíclico", "heterocíclico", "heteroaril alcoxi más bajo", "R3a y R3b pueden formar juntos un anillo", "alcoxi más bajo", entre otras, corresponden a géneros funcionales y a términos imprecisos, lo cual no permite distinguir la invención del estado de la técnica; de acuerdo con lo anterior se sugiere definir los significados de estos radicales y restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que ha sido sintetizado ó probado, es decir, que se encuentran debidamente sustentados con la actividad biológica que se les atribuye, como inhibidores de la producción β amiloide. Adicionalmente, se mencionan los solvatos y de estos no existe soporte en la descripción.

La reivindicación 16 reclama una composición que comprende compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 14, por lo tanto se repite la materia reclamada en la reivindicación 15 innecesariamente; se advierte que una composición se

caracteriza por los componentes que la constituyen compuesto (s) activo (s) y excipiente (s) y no por su actividad farmacológica.

El capítulo reivindicatorio no es conciso porque contiene 4 reivindicaciones independientes, lo cual hace difícil definir cuál es el objeto que se busca proteger.

Se requiere al Solicitante hacer las aclaraciones necesarias.

7. Unidad de invención (Art 25 D 486)

La Solicitud no cumple con el Requisito de Unidad de Invención porque se refiere a 2 Grupos Inventivos.

Los Grupos Inventivos están definidos por las siguientes características esenciales:

1° Compuestos en los cuales está presente el anillo de tiazina como en las reivindicaciones 1, 3-6 y 9-15.

2° Compuestos en los cuales está presente el anillo de tiazol como en las reivindicaciones 2, 7-8, 10-15.

Se sugiere presentar las Solicitudes Divisionales que considere necesarias, ó limitar la solicitud inicial a una sola invención, eliminando de ella las otras invenciones.

8. 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: Junio 13 de 2008 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Nº	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	US2009/0082560 (WO2007049532)	Aminodihydrothiazine Derivatives	3 de mayo 2007

D1¹ divulga compuestos de fórmula (I-11), (I-3) con actividad como inhibidores de la producción β amiloide para tratar enfermedades inducida por la producción, secreción y/o depositación de la proteína β amiloide.

9. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

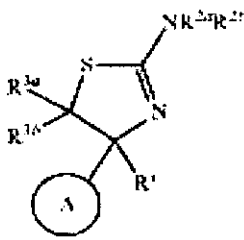
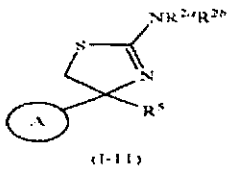
Novedad (Art 16 D486)

-La reivindicación 2, consiste en un compuesto de fórmula II.

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

Características esenciales	D1
-----------------------------------	----

¹http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=11&ND=5&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20070503&CC=WO&NR=2007049532A1&KC=A1
Expediente 10-154098 1er Art 45

	 párrafo 124, pág.17
A= grupo carbocíclico o heterocíclico opcionalmente sustituido	A= grupo carbocíclico o heterocíclico opcionalmente sustituido (párrafo 11, pág. 2, columna izq.)
R ^x = grupo carbocíclico o heterocíclico opcionalmente sustituido	R5=R4b=grupo carbocíclico o heterocíclico opcionalmente sustituido cuando m=1(párrafos 11, pág.1 y 12, pág. 2)
R2a y R2b=H	R2a y R2b=H (párrafos 11, pág.1 y 12, pág. 2)
R3a y R3b= H, H	H, H

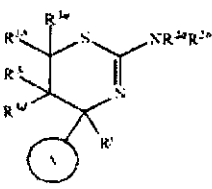
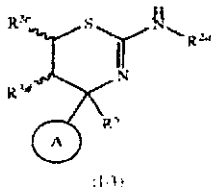
Las características esenciales de la composición de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en D1, el cual enseña, el compuesto específico (I-11, párrafo 124, pág.17)

En consecuencia, la reivindicación 2 no es nueva, según lo divulgado en el documento D1.

Las reivindicaciones dependientes 7 – 8, 10-15 no mencionan alguna característica que haga nuevo al compuesto de la reivindicación 2, por lo cual se considera que no son nuevas.

-La reivindicación 3, consiste en un compuesto de fórmula III.

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

Características esenciales	D1
	 Párrafo 69, pág. 11
A= grupo carbocíclico o heterocíclico opcionalmente sustituido	A= grupo carbocíclico o heterocíclico opcionalmente sustituido
Ry= halógeno, alquilo bajo opcionalmente sustituido.	R5= R4b= halógeno, alquilo bajo opcionalmente sustituido cuando m=1(párrafos 11, pág.1 y 12, pág. 2)
R2a y R2b=H	H y R2a=H (párrafo 62, pág.10)
R3a, R3b=H y H	H,R3c=H (párrafo 65, pág.11)
R3c, R3d=H y H	H y R3d=H (párrafo 65, pág.11)

Las características esenciales de la composición de la reivindicación 3 habían sido divulgadas previamente en D1, el cual enseña, el compuesto específico (I-3, Párrafo 69, pág. 11)

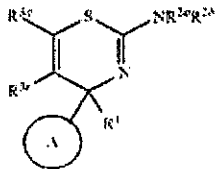
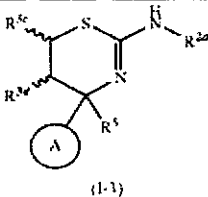
En consecuencia, la reivindicación 3 no es nueva, según lo divulgado en el documento D1.

Las reivindicaciones dependientes 9-15 no mencionan alguna característica que haga nuevo al compuesto de la reivindicación 3, por lo cual se considera que no son nuevas.

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1, consiste en un compuesto de fórmula I.

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

Características esenciales	D1
	
A= grupo carbocíclico o heterocíclico opcionalmente sustituido	A= grupo carbocíclico o heterocíclico opcionalmente sustituido Párrafo 69, pág. 11
R1=alquilo bajo opcionalmente sustituido, alquenilo bajo opcionalmente sustituido, carbocíclico o heterocíclico opcionalmente sustituido.	R5=R4b alquilo bajo opcionalmente sustituido, alquenilo bajo opcionalmente sustituido, grupo carbocíclico o heterocíclico opcionalmente sustituido. cuando m=1(párrafos 11, pág.1 y 12, pág. 2)
R2a y R2b=H,H	R2a y H (párrafo 62, pág.10)
R3a y H	R3c y H (párrafo 65, pág.11)
R3c y H	R3d y H (párrafo 65, pág.11)

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga un compuesto de fórmula (I-3, Párrafo 69, pág. 11).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto de D1 consiste en la instauración en la posición 5,6 del anillo de tiazina.

A pesar de esta diferencia, no se logra un efecto sorprendente por la eliminación de los H en el anillo 5,6-dihidro- 4H-1,3- tiazina para obtener el anillo 4H-1,3-tiazina.

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo modificar el compuesto del D1, para lograr uno alternativo, con la misma actividad".

Sin embargo, el ensayo de inhibición de actividad de β secreatasa divulgado en la tabla 21, págs.172 y 175, Fls.354 y 355, muestra valores de IC50, de los compuestos reclamados, comparables con los divulgados, para los compuestos conocidos, en la tabla 170, pág. 222, para la misma actividad como inhibidores de actividad de β

Expediente 10-154098 1er Art 45

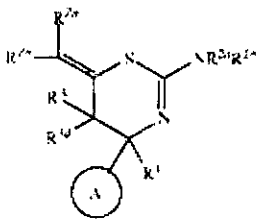
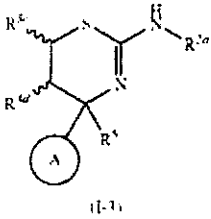
secreatasa; por lo anterior no se puede evidenciar un efecto técnico sorprendente en el compuesto reivindicado.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, eliminaría los H del compuesto de D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 5 y 6, 10-15 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

-La reivindicación 4, consiste en un compuesto de fórmula IV.

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

Características esenciales	D1
	
A= grupo carbocíclico o heterocíclico opcionalmente sustituido	A= grupo carbocíclico o heterocíclico opcionalmente sustituido Párrafo 69, pág. 11
R1=alquilo bajo opcionalmente sustituido, alquenilo bajo opcionalmente sustituido, carbocíclico o heterocíclico opcionalmente sustituido.	R5=R4b alquilo bajo opcionalmente sustituido, alquenilo bajo opcionalmente sustituido, grupo carbocíclico o heterocíclico opcionalmente sustituido, cuando m=1(párrafos 11, pág.1 y 12, pág. 2)
R2a y R2b=H,H	R2a y H (párrafo 62, pág.10)
R3a y H	R3c= alquenilo bajo opcionalmente sustituido y H (párrafo 65, pág.11)
R3c y H	R3d y H (párrafo 65, pág.11)

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga un compuesto de fórmula (I-3, Párrafo 69, pág. 11).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto de D1 consiste en la presencia del grupo alquenilo sustituido en la posición 5 del anillo de tiazina.

No obstante la diferencia, no se logra un efecto sorprendente.

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo modificar el compuesto del D1, para lograr uno alternativo, con la misma actividad”.

Sin embargo este mismo documento divulga que en la posición 5 del anillo de tiazina puede estar un grupo alquenilo sustituido, cuando 3c significa grupo alquenilo opcionalmente sustituido.

Cabe mencionar, que el ensayo de inhibición de actividad de β secretasa divulgado en la tabla 21, págs. 172 y 175, Fls. 354 y 355, muestra valores de IC50, de los compuestos reclamados, comparables con los divulgados, para los compuestos conocidos, en la tabla 170, pág. 222, para la misma actividad como inhibidores de actividad de β secretasa; por lo anterior no se puede evidenciar un efecto técnico sorprendente en el compuesto reivindicado.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, eliminaría los H del compuesto de D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 4 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 6, 10-15 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

10. Conclusión

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

Nº	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	US2009/0082560 (WO2007049532)	2,7-8,10-15 3, 9-15 1, 5 y 6, 10-15	Novedad Novedad 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 2 OCT. 2012

Elaborado por: Lyna del Carmen Mordecay Dunoyer
Revisado Por: Gloria Jacqueline Alfonso Rozo
Aprobado por: José Luis Salazar López. *OK*
Expediente 10-154098 1er Art 45