

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 11-9242- -12	FECHA: 2013-06-05 13:24:45
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 5
ACT: 519 PRESENTACION	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
CARLOS REINALDO OLARTE GARCIA

Asunto: Radicación: 11-9242- -12
Trámite: 11
Evento: 378
Actuación: 519
Oficio: 9999
Folios: 5

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/EP2009/059763				
Fecha de Presentación Internacional	28/07/2009				

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 15 a 85	27/Enero//2011
	Folios 86 a 151	27/Enero//2011
Reivindicaciones:	Folios 152 a 154	27/Enero//2011
	Folios 191 a 194	30/Junio/2011
Dibujos:	Folios 14 a 151	27/Enero//2011
Prioridad:	EP 081613697	29/Julio/2008

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.

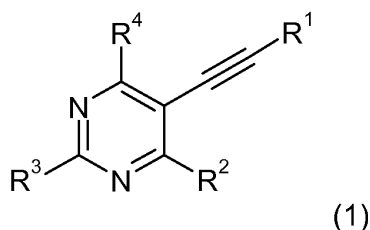
3. Objeto de la invención

De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del Capítulo Primero del Título X 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. Con relación a la presente solicitud se realizó el pago de las reivindicaciones adicionales y se estudiarán las reivindicaciones 1 a 11.

Título de la solicitud: “5-Alquinil-pirimidinas”.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar compuestos de fórmula general 5 alquinil- pirimidinas útiles como inhibidores de quinasa y su aplicación en el tratamiento de enfermedades inmunológicas, inflamatorias y cáncer.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de la fórmula (I) y composiciones que lo contienen, que se caracteriza por presentar un anillo básico de 5- alquil pirimidina .



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 239/48.

4 . De la solicitud de patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

Las reivindicaciones 1, 5 a 7 y 11 no son claras porque la expresión opcionalmente, o al menos, precediendo una característica no es limitativo, porque hace opcional a la característica y no precisa el alcance de la reivindicación. Se sugiere incluir las características opcionales o preferentes en una reivindicación dependiente.

Las reivindicaciones 8 y 9 no son claras porque definen el compuesto en términos de su acción farmacológica o su forma de preparación. Se sugiere definir el compuesto por sus características esenciales, estructurales o funcionales.

La reivindicación 1 no es concisa porque las definiciones de R1, R2, R3 y R4, se describen en términos de géneros funcionales. Se sugiere restringir la solicitud a una razonable generalización de los tipos de compuestos que han sido sintetizados ó probados, es decir, que se encuentran debidamente sustentados en la descripción, de acuerdo a lo presentado en la tabla No1.

Tabla No 1. Los radicales que están soportados en los ejemplos dentro del capítulo descriptivo y que se encuentran dentro del alcance del compuesto de fórmula (I) en la reivindicación 1 son:

RADICAL	SOPORTE DE LOS EJEMPLOS PRESENTADOS
R1	
R2	
R3	NH ₂
R4	CH ₃

La reivindicación 11 no está sustentada en la descripción porque, la misma reclama la presencia dentro de la composición farmacéutica de al menos otra sustancia con actividad citostática o citotóxica. Los ejemplos sustentados dentro del capítulo descriptivo no soportan esta característica. Se sugiere incorporarla a la descripción para dar soporte. Esta modificación no supone ampliación puesto que las reivindicaciones iniciales se presentaron con la descripción (Art. 26 D 486).

Se requiere al solicitante hacer las aclaraciones necesarias.

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, es decir, julio 29 de 2008. Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	WO 2006/044823	“Heteroaryl-substituted alkyne compounds and method of use”	27/Abril/2006
D2	WO 02/08205	“Substitutes 5-alkynil pyrimidines having neurotrophic activity”	31/Enero/2002

El documento D1 ⁽¹⁾ divulga compuestos y composiciones farmacéuticas que son usados como moduladores de las proteínas quinasas para tratar enfermedades mediadas por estas, tales como: enfermedades antiinflamatorias, diabetes, enfermedades autoinmunes, alergias, y en el tratamiento del cáncer entre otras (Pág. 2 (líneas 7 a 12) y Pág 237 a 241)).

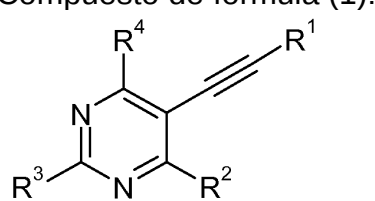
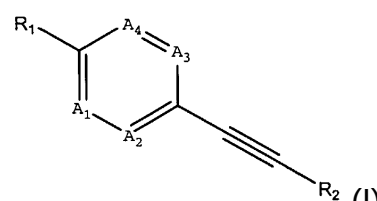
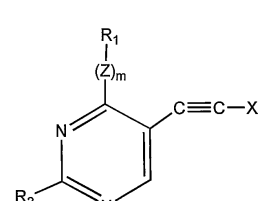
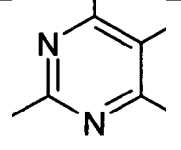
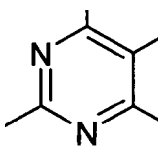
El documento D2 ⁽²⁾ divulga compuestos nuevos de 5-alquil pirimidinas sustituidas, los cuales se usan en el tratamiento de trastornos generados por el sistema nervioso central como problemas degenerativos, lesiones neuronales, y trastornos por ejemplo como la epilepsia, enfermedad de Alzheimer entre otras (Pág. 1 (líneas 1 a 7)).

6. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en compuestos de fórmula general (1) en la que: R1 es cicloalquilo C3-8, R2 es cicloalquilo C3-8, R3 es hidrógeno, R4 es alquilo C1-3, opcionalmente sustituidos;

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

Características esenciales	D1	D2
Compuesto de fórmula (1):  (1)	Compuesto de fórmula (I):  (Pág.260 , líneas 1 a 4)	Compuesto de fórmula (I):  (Pág.46 , líneas 3 a 7)
R1= cicloalquilo C3-8, heterocicloalquilo C3-8. arilo C6-10 y heteroarilo C5-12, los cuales pueden estar opcionalmente sustituidos	R2= es un monociclo de 5 a 8 miembros saturado o insaturado, el cual puede contener de 1 a 3 heteroátomos (O, N y/o S) y pueden estar sustituidos (Pág.260 , líneas 20 a 26)	X= arilo de C6-10, opcionalmente sustituido (Pág. 47, líneas 16 a 17)
	Dónde: A1= N A2= CR4, siendo R4 hidrógeno A3= CR5, siendo R5 hidrógeno A4= N (Págs.260 (líneas 8 a 11), 261 (línea 30) y 262 (línea	

1. [http://worldwide.espacenet.com/searchResults?](http://worldwide.espacenet.com/searchResults?compact=false&ST=singleline&query=wo2006044823&locale=en_EP&DB=worldwide.espacenet.com)

compact=false&ST=singleline&query=wo2006044823&locale=en_EP&DB=worldwide.espacenet.com

2. [http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20020131&CC=WO&NR=0208205A1&KC=A1)

DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20020131&CC=WO&NR=0208205A1&KC=A1

	9))	
R2= arilo C6-10, cicloalquilo C3-8, heterocicloalquilo C3-8. arilo C6-10 y heteroarilo C5-12, los cuales pueden estar opcionalmente sustituidos	A2 es CR4, dónde R4 es: cicloalquilo C3-10, y heterocicloalquilo C3-10, opcionalmente sustituidos con R9 ((Págs.260 (línea 9), 261 (líneas 30 a 33) y 262 (líneas 1 a 2)) No se menciona el reemplazo por un arilo	$\begin{array}{c} \\ (Z)_m \\ \\ R_1 \end{array}$ Dónde: m= cero R1= arilo C5-10, alquilo C2-6, heterocicloalquilo C2-9, heteroarilo C1.6, los cuales pueden estar sustituidos opcionalmente (Pág. 46 , líneas 11 a 16)
R3= -NRcRc., siendo Rc hidrógeno	R1= NR7R7, siendo R7 hidrógeno (Págs. 260 (líneas 14-19), 263 (líneas 1-5, 12-15,))	NH2 (Pág.47 , línea 14)
R4= alquilo C1-3, cicloalquilo C3-8, heterocicloalquilo C3-8, -ORc, -NRcRc. CF3, -CN, -NC y -NO2	A3 es CR5, dónde R5 es: NO2, -CN, NR7R7 (R7 hidrógeno), OR7, alquilo C1-10, cicloalquilo C3-10 (Págs. 260 (línea 10) y 262 (líneas 9-14))	Hidrógeno (Pág.46 , líneas 3 a 7)

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 divulga compuestos y composiciones farmacéuticas que son usados como moduladores de las proteínas quinasas para tratar enfermedades mediados por estas, como: enfermedades antiinflamatorias, diabetes, enfermedades autoinmunes, alergias, y en el tratamiento del cáncer entre otras (Págs. 2 (líneas 7 a 12) y 237 a 241). Por su parte el documento D2 define compuestos nuevos de 5-alquinil pirimidinas sustituidas, los cuales se usan en el tratamiento de trastornos generados por el sistema nervioso central como problemas degenerativos, lesiones neuronales, y trastornos por ejemplo como la epilepsia, enfermedad de Alzheimer entre otras (Pág. 1 (líneas 1 a 7)).

La diferencia entre la invención definida en el compuesto de fórmula (I), y el compuesto de definido en el documento D1, consiste en que el compuesto reivindicado presenta para la definición de R2 un grupo arilo sustituido, el cual se encuentra unido a la pirimidina. Para el caso del compuesto definido en el documento D1, la definición de A2 no menciona un reemplazo por un arilo.

El efecto técnico de incluir un grupo arilo sustituido unido a la pirimidina consiste en mejorar la actividad quinasa de los compuestos reclamados ($EC_{50} < 0,1 \mu M$) (Fl.148, línea 14).

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo proveer compuestos derivados de pirimidinas que presenten una mejor actividad quinasa”.

Sin embargo, aunque el compuesto de fórmula (I) definido en el documento D1 carece de manera específica de un arilo sustituido unido a la piperidina en la posición 5; el documento D2 divulga compuestos de 5-alquinil pirimidinas sustituidas, los cuales presentan un grupo arilo sustituidos en la misma posición (Pág. 46 , líneas 11 a 16)). Asimismo, el documento D2 define una actividad EC_{50} para sus compuestos de $0,1 \mu M$ (Pág. 45, Ej. 9). Al comparar los resultados de actividad inhibitoria de los

compuestos reclamados con la actividad definida en el documento D2, se observa que no hay un efecto sorprendente por parte de la invención.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría el grupo arilo sustituido unido a la pirimidina en la posición 3 divulgado en D2, en el compuesto definido en el documento D1 para llegar así a los compuestos de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2-11 no mencionan características técnicas esenciales de los compuestos derivados de pirimidinas sustituidas de la fórmula general (I), tampoco se pueden considerar inventivas.

7. Conclusión

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

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO 2006/044823	1 – 11	Nivel Inventivo
D2	WO 02/08205	1 – 11	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 2013-06-11

Elaboró: German Antonio Clavijo Cohen

Revisó: Consuelo Leguizamon Leguizamon