

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

2020

Bogotá, D.C., 25 de septiembre de 2007

Abogada

ALICIA LLOREDA

Solicitante: PHARMACIA ITALIA S.p.A

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

**No. 03-018884- -00006-0000**

Fecha: 2007-10-11 12:20:12 Dep. 2020 DIR.NUEVASC
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALI
Act. 519 TRASLADOINFORME Folios: 1

ASUNTO	03-18884
Trámite	002
Evento	001
Actuación	430
Oficio	
Folios	14

13049

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 le comunica:

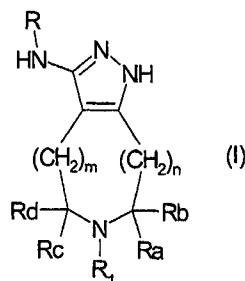
1. Documentos estudiados

- | | | |
|------|--------------------------|--|
| 1.1. | <u>Descripción:</u> | Folios: 25 a 364 como se radicó inicialmente |
| 1.2. | <u>Reivindicaciones:</u> | Folios 365 a 472 como se radicó inicialmente |
| 1.3. | <u>Prioridad:</u> | Folio: 1.
Número: US09/635,914.
Fecha: 10-08-2000. |

2. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "Biciclopirazoles Activos como Inhibidores de Quinas, Procedimiento para su Preparación y Composiciones Farmacéuticas que lo Contienen" (folio 25)

El objeto de la presente solicitud de patente de invención consiste en derivados de:



Reivindicaciones 1–9 y 11: Un compuesto de la fórmula (I)

Reivindicación 10: Una composición farmacéutica.

Reivindicaciones 12 y 13: El uso de un compuesto de la fórmula (I).

Reivindicaciones 14 a 20: Un procedimiento para la síntesis de derivados de (I).

Reivindicaciones 21 y 22: Una biblioteca química.

Reivindicaciones 23 a 27: Un método de tratamiento.

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de compuestos útiles para tratar enfermedades ligadas a proteínas quinasas desreguladas.

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio proporciona composiciones que contienen derivados de biciclopirazol de la fórmula (I) y un vehículo y/o un diluyente farmacéuticamente aceptable.

La invención se catalogó según la Clasificación Internacional de Patentes (IPC.) como: CO7C 487/04, A61K 31/4162.

3. De la solicitud de Patente

3.1. Descripción (artículo 28 D. 486)

La descripción en sus folios 154 a 166, muestra diversos métodos de ensayo de inhibición de la actividad cdk2/ciclina A, E, B1, C1, ensayo de inhibición de actividad MAPK, EGFR, IGF1-R, cdk5/p25, Cdc7/dbf4 y aurora 2. Sin embargo el solicitante no presenta ningún tipo de dato o resultado referente a la evaluación de las sustancias que se desean proteger frente a estas técnicas, por lo tanto la descripción no divulga cómo las sustancias presentadas en la solicitud realmente son una solución al problema técnico planteado como reguladores de la proteína

quinasa. Adicionalmente las sustancias de la presente solicitud no fueron comparadas con otras sustancias conocidas en el estado de la técnica, útiles para el mismo fin; por lo anterior la descripción no establece en forma clara la actividad de estos derivados de biciclopirazol.

Por lo anterior la descripción no cumple con el requisito de claridad o comprensión de acuerdo al art. 28 de la Decisión 486.

3.2. Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

Las reivindicaciones 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8 y 21 utilizan palabras o frases muy generales para describir los sustituyentes, lo que da lugar a una muy amplia cantidad de compuestos, de los cuales no se encuentra soporte suficiente en la descripción que permita establecer que todos estos compuestos son una solución al problema técnico planteado. Entre tales palabras o frases se encuentran:

“opcionalmente sustituido”, “alquilo C₁-C₆”, “cicloalquilo C₃-C₆”, “alquileo C₄-C₆”, “recto o ramificado”, “arilo”.

Por lo anterior estas reivindicaciones no son concisas en cuanto al alcance de la materia que se desea proteger con la presente solicitud. Se le recomienda al solicitante que delimite claramente los sustituyentes que le permiten obtener los compuestos con la actividad sobre las proteínas quinasas.

La reivindicación 11 caracteriza un compuesto por su uso como medicamento. Por lo general un compuesto debe ser caracterizado por su estructura química y sus radicales. Se le recomienda al solicitante modificar estas reivindicaciones de acuerdo con lo explicado.

La reivindicación 14 en la sección a' habla de hacer reaccionar un compuesto de fórmula (I) con una resina de isocianato. No es claro si el compuesto (I) que desean hacer reaccionar con dicha resina se refiere a cualquiera de los compuestos derivados de (I) o solo a aquellos en que R es hidrógeno. Se le recomienda al solicitante que aclare cuáles son los compuestos que se van a utilizar.

Las reivindicaciones 21 y 22 tratan de una “biblioteca química combinatoria” este término no es utilizado técnicamente para designar a un conjunto de moléculas. Por lo tanto, si lo que el solicitante desea proteger es el conjunto de compuestos derivados de la fórmula V, debe modificar el preámbulo de estas reivindicaciones

de tal forma que sea clara la materia a la cual el solicitante esta haciendo referencia.

Por lo anterior, las reivindicaciones mencionadas no cumplen con el requisito de claridad, concisión o sustento por la descripción de acuerdo al art. 30 de la Decisión 486.

4. Excepción a la patentabilidad (artículo 20 D486 literal d))

Las reivindicaciones 23-27 tratan de un método para tratar una enfermedad asociada a la actividad alterada de la proteína quinasa. Por lo tanto estas reivindicaciones no son objeto de patente.

5. Reivindicaciones relativas a un uso o a un uso distinto (artículos 14 y 21 D 486)

Las reivindicaciones 12 y 13 hablan del uso de los compuestos de la fórmula (I) o una sal farmacéuticamente aceptable. Por tal motivo estas reivindicaciones no son patentables.

6. Determinación del Estado de la Técnica

Considerando que la fecha de presentación de la primera solicitud de patente de la cual se reivindica prioridad es: 10-08-2000, se buscaron documentos del estado de la técnica relacionados, con fecha de publicación anterior a esta.

N°	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	Sho 48-3639	PIPERIJIN YUDOTAI NO SEIZO HOHO	01-02-1973
D2	ZA9811178	USE OF PYRAZOLO [3,4-b] PYRIDINE AS CYCLIN DEPENDENT KINASE INHIBITORS	07-06-2000

El documento del Estado de la Técnica más próximo es D2 que enseña compuestos de biciclopirazol (Ver folios: 501 y 502), que son moduladores de proteína-quinasa.

La única diferencia con D2 es que esta solicitud menciona que el anillo unido al grupo pirazol no es aromático. Pero estas no parecen conceder un efecto técnico inesperado porque estos compuestos siguen siendo moduladores de proteína-quinasa.

El problema técnico planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de compuestos útiles para tratar enfermedades ligadas a proteínas quinasas desreguladas; este problema se había resuelto previamente mediante el mismo tipo de compuestos ya conocidos. Por esta razón se considera que la formación de bicíclos con el pirazol para el tratamiento de enfermedades como el cáncer, es evidente para una persona medianamente versada en la materia.

Además, puesto que tanto D1 como D2 divulgaban previamente (folios: 496, 501 y 502) que los compuestos del bicíclo-pirazol poseen actividad farmacológica, por lo cual una persona conocedora de la materia motivada por tal sugerencia lograría los compuestos de esta solicitud, que son moduladores de proteína-quinasa; de manera que para una persona medianamente versada en la materia sería obvio combinar estos dos documentos. Por lo cual las reivindicaciones 1-9 y 11 y las composiciones de la reivindicación 10 no tienen Nivel Inventivo.

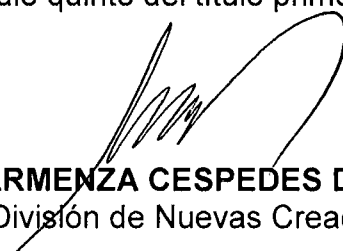
8. Conclusión:

Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

Nº	Documento Nº	Reivindicaciones Afectadas	Requisito que Afecta
D1	Sho 48-3639	1-11 y 14-20 1-11	Novedad Nivel inventivo
D2	ZA9811178	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 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.

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



ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Jefe de División de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha
10 2 OCT. 2007

CONCEPTO TECNICO
No. 1711

EXAMINADOR TECNICO
Código No. 202073

Nº de...