

OLARTEMOURE

OLARTE MOURE & ASOCIADOS LTDA.

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. S. D.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-058067-00008-0000

Fecha: 2013-06-26 16:12:04
Tra. 11 PATENTE IYII
Act. 523 RESPUESTA

Dep. 2020 DIR. NUEVAS CR
Eve: 378 FASE NACIONAL I
Folios: 7

Carlos R. Olarte
Juan G. Mouré
Alexander Agudelo
Carlos A. Parra
Juan Felipe Acosta
Andrés Rincón
Mónica Guevara
Andrés Alvarado
Ella Ponce
Liliana Galindo
Claudia Clara Calderón
Mauricio Ávila
Laura Escobar
José Jairo Dangond
Gina Cáceres
Isabella Herrera
Zaava Ravid

Medellín
María Clara Múnera

Re: Expediente No. 11-058.067

Solicitud de Patente de Invención titulada: "PIRAZOLILAMINOPIRIDINAS COMO INHIBIDORES DE FAK".

Solicitante: GLAXOSMITHKLINE LLC

Nuestra Ref.: P2011/000087

RESPUESTA AL OFICIO No. 1935, NOTIFICADO POR FIJACIÓN EN LISTA No. 007
DE FECHA 12 DE FEBRERO DE 2013
(PRIMER EXAMEN DE FONDO)

CARLOS R. OLARTE, mayor de edad y vecino de Bogotá, identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi carácter de apoderado de la sociedad solicitante, me permito manifestar lo siguiente ante el auto emanado por ese Despacho, dentro del plazo legal de prórroga previsto en el artículo 45 de la Decisión 486, en los siguientes términos:

1. En primer lugar, con el ánimo de brindar mayor claridad a la materia reivindicada, me permito presentar un **Capítulo Reivindicatorio Modificado**, que reemplaza en su totalidad el Capítulo Reivindicatorio presentado al momento de radicar la solicitud, que ahora reclama únicamente el Ejemplo 41 o una sal del mismo, y una composición que lo contiene.

Valga anotar que las modificaciones efectuadas al Capítulo Reivindicatorio cumplen a cabalidad con lo estipulado en el Artículo 34 de la Decisión 486, ya que éstas de ninguna manera implican una ampliación de la protección correspondiente a la divulgación contenida en la solicitud inicial, por el contrario, éstas corresponden a una franca limitación de la materia reclamada.

2. a- El Examinador señala que la Reivindicación 13 reclama materia no patentable.

b- Considero superada la anterior objeción, en tanto que la Reivindicación 13 ha sido eliminada del Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto.

3. a- El Examinador señala que la Reivindicación 1 es excesivamente amplia porque comprende términos indefinidos tales como alquilo_{C1-6}, cicloalquilo_{C3-6}, alquenilo_{C2-6}, alcoxi_{C1-6}, (alquilenio_{C1-4})_q, entre otros, y comprende sustituyentes secundarios no evidentes de la Fórmula I y con varias posibilidades de sustitución.

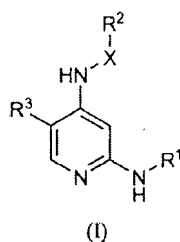
El Examinador sugiere limitar la materia reclamada a una generalización razonable de los ejemplos, sugiriendo sustituyentes y valores específicos para R¹, R², R³, R¹¹, R¹², R¹³, Q y Z.

Finalmente, el Examinador señala que la Reivindicación 11 también contiene un número excesivo de compuestos específicos. Por lo tanto, el Examinador sugiere restringirla a los compuestos de real interés para el inventor y que poseen la mejor actividad inhibitoria de FAK kinasa.

b- Sin perjuicio del hecho que un inventor está en su derecho de reclamar protección para la totalidad de un concepto inventivo desarrollado, sin importar la amplitud de éste, siempre y cuando se conserve el principio de unidad de invención y no haya arte previo que afecte su patentabilidad (una reivindicación puede ser tan amplia como se requiera para así poder enmarcar la totalidad del concepto inventivo desarrollado y no solamente las modalidades preferidas o específicamente ejemplificadas en la solicitud) y que no existe requerimiento legal alguno que determine que los ejemplos deban ilustrar todos y cada uno de los compuestos que se encuentran dentro del alcance de la invención, en el presente caso, considero superadas las anteriores objeciones del Examinador, en tanto que el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto ha sido limitado al compuesto del Ejemplo 41 del Capítulo Descriptivo, o una sal del mismo, y una composición farmacéuticamente aceptable que lo contiene.

4. a- El Examinador señala que la patente WO2008/115369 (D1), afecta el nivel inventivo de la presente invención.

El Examinador argumenta que D1 divulga compuestos derivados de diamino-piridina, activos como inhibidores de Kinasa de Adhesión Focal (FAK) para el tratamiento del cáncer, de fórmula:

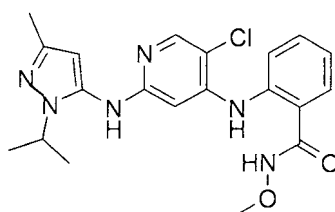


El Examinador presenta un cuadro comparando las características estructurales de los compuestos aquí reclamados con los compuestos divulgados en D1, y afirma que la diferencia entre la presente invención y D1 es que para la invención, el amino en posición 2 del anillo de piridina se sustituye específicamente por un pirazol que posee sustituyentes R^{11} , R^{12} y R^{13} , mientras que en D1, dicho amino se sustituye preferiblemente por un fenil que posee sustituyentes Y.

Sin embargo, el Examinador afirma que esta diferencia podría ser derivada de la enseñanza de D1 porque en dicho documento, el grupo amino en posición 2 del anillo de piridina también puede ser sustituido por un anillo monocíclico, bicíclico, policíclico aromático que contiene de 0 a 3 heteroátomos de N, O o S (que puede ser un pirazol) que comprende de 0 a 5 sustituyentes Y.

El Examinador concluye que una persona medianamente versada en la materia siguiendo las enseñanzas de D1 podría haber producido los compuestos de la invención, dado que encontraría las sugerencias suficientes para lograrlos, sin proveer un efecto técnico inesperado por lo cual la presente invención se considera obvia.

b- i) En primer lugar, llamo nuevamente la atención del Examinador sobre las drásticas limitaciones realizadas en el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto, donde el compuesto reclamado es únicamente el Ejemplo 41 que presenta la siguiente estructura:



Ejemplo 41

2-[(5-cloro-2-{[3-metil-1-(1-metiletil)-1H-pirazol-5-il]amino}-4-piridinil)amino]-N-(metiloxi)benzamida, o sales del mismo.

ii) Con respecto al arte previo citado por el Examinador, me permito resaltar lo siguiente:

- Si bien es cierto que D1 divulga compuestos derivados de 2,4-diaminopiridinas 5-sustituidas, activos como inhibidores de kinasa de adhesión focal (FAK), es importante resaltar que este documento no divulga, ni se acerca estructuralmente, al compuesto de la presente invención, particularmente porque ninguno de los ejemplos de D1 presenta compuestos con un anillo pirazol que sustituye el amino de la posición 2 del núcleo de piridina;
- D1 tampoco provee enseñanza o sugerencia alguna que motive a incluir un grupo metoxi en el grupo amino del sustituyente benzamida del núcleo de piridina (el sustituyente R en D1 no puede ser alcoxi).

En el presente caso, la persona medianamente versada en la materia con conocimiento de D1, no tendría enseñanza o sugerencia alguna que lo llevara a sintetizar particularmente el compuesto aquí reclamado, dado que ninguno de los 110 Ejemplos contenidos en D1, solos o en combinación, siquiera se acerca estructuralmente al de la presente invención.

En conclusión, la persona medianamente versada en la materia siguiendo las enseñanzas de D1 no habría encontrado motivación o enseñanza alguna que lo llevara a sintetizar específicamente el compuesto 2-[(5-cloro-2-{[3-metil-1-(1-metiletil)-1H-pirazol-5-il]amino}-4-piridinil)amino]-N-(metiloxi)benzamida de la presente invención, con la estructura particular reivindicada, y a la vez proporcionara los efectos biológicos que se obtuvieron. De hecho, las enseñanzas de D1 conducirían a dicha persona lejos de la presente invención, ya que este documento puede sesgarlo a producir compuestos estructuralmente diferentes.

Así las cosas, me permito afirmar que la única forma en que una persona medianamente versada en la materia podría llegar a la sustitución que menciona el Examinador en su examen de fondo sería al realizar un análisis en retrospectiva una vez conoce la invención aquí reclamada.

iii) Ahora bien, con respecto a los efectos técnicos inesperados de la presente invención, me permito llamar la atención del Examinador sobre los datos biológicos incluidos en la Tabla A del Capítulo Descriptivo en los cuales se presentan los resultados del Ensayo 1, que corresponde al ensayo bioquímico de la actividad FAK, por control de la fosforilación de un

5

sustrato peptídico en presencia de un ATP radiomarcado; y del Ensayo 2, que corresponde al ensayo bioquímico de la actividad FAK, por control de la fosforilación de un sustrato LANCE Ultra NH₂-(ULight)-CSFTDDYAEIID-COOH (ver Páginas 28 a 32).

De acuerdo con la Tabla A, el compuesto de la presente invención (Ejemplo 41) presentó los siguientes resultados particulares:

- Ensayo 1: FAK TRF PXC₅₀ = 9,4
- Ensayo 2: FAK II 31284A TRF PX C₅₀ = 8,7

Considerando lo anterior, no es posible predecir que la estructura particular del compuesto reclamado podría proveer la actividad demostrada. Por lo tanto, una persona medianamente versada en la materia no habría esperado llegar a los resultados obtenidos con la presente invención con base en las enseñanzas contenidas en D1.

A la luz de lo anterior, y según los lineamientos del Manual Andino de Patentes (MAP), debe reconocerse que las invenciones en el campo de la química tienen nivel inventivo cuando tienen una estructura inesperada (no derivable por la persona medianamente versada en la materia), o presenten un efecto técnico inesperado o mejorado impredecible del arte previo.¹ En el presente caso, no solo la estructura de los compuestos es inesperada, sino también la actividad proporcionada por las mismas, lo cual es una clara evidencia de nivel inventivo.

5. Finalmente, me permito informar que para el concepto inventivo comprendido en la presente solicitud, ha sido otorgado hasta el momento el privilegio de patente en Algeria, Marruecos y Sur África.

Si bien es cierto que las concesiones de patentes en oficinas de otros países no son vinculantes en el sentido que obliguen a la SIC a tomar una decisión en el mismo sentido, considero que dichas concesiones sugieren el cumplimiento de los requisitos de patentabilidad de la materia reivindicada, ya que los criterios de evaluación y estudio aplicados para concluir la aceptación de dichas patentes resultan equivalentes a los que la SIC debe emplear.

¹ Manual Andino de Patentes. (2004). Sección 10.8.1 (disponible en <http://www.comunidadandina.org/public/patentes.pdf>)

OLARTEMOURE

OLARTE MOURE & ASOCIADOS LTDA.

6. Por todo lo anterior, considero que las objeciones presentadas por el Examinador en su examen de fondo, han sido resueltas y por consiguiente solicito respetuosamente que el Despacho tenga por cumplidos los requisitos de patentabilidad y proceda con la concesión de la patente.

Atentamente,



CARLOS R. OLARTE

C.C. No. 79.782.747 de Bogotá

T.P. 74.295

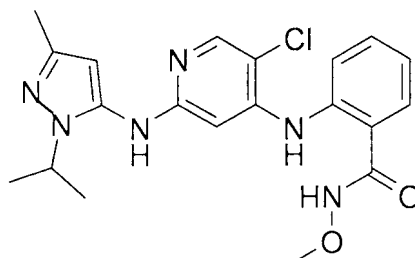
Anexo: Capítulo Reivindicatorio Modificado



CAPÍTULO REIVINDICATORIO MODIFICADO

(Primer Examen de Fondo)

1. Un compuesto que es 2-[(5-cloro-2-{[3-metil-1-(1-metiletil)-1*H*-pirazol-5-il]amino}-4-piridinil)amino]-*N*-(metiloxi)benzamida, el cual es un compuesto de Fórmula:



o una sal del mismo.

2. Una sal farmacéuticamente aceptable de 2-[(5-cloro-2-{[3-metil-1-(1-metiletil)-1*H*-pirazol-5-il]amino}-4-piridinil)amino]-*N*-(metiloxi)benzamida.

3. El compuesto que es 2-[(5-cloro-2-{[3-metil-1-(1-metiletil)-1*H*-pirazol-5-il]amino}-4-piridinil)amino]-*N*-(metiloxi)benzamida.

4. Una composición farmacéuticamente aceptable que comprende 2-[(5-cloro-2-{[3-metil-1-(1-metiletil)-1*H*-pirazol-5-il]amino}-4-piridinil)amino]-*N*-(metiloxi)benzamida, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo y un excipiente farmacéuticamente aceptable.
