

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

2020

Bogotá, D.C., Noviembre 23 de 2007

Abogado
CARLOS R. OLARTE

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

**No. 03-065412- -00002-0000**

Fecha: 2007-12-06 14:29:12 Dep. 2020 DIR.NUEVASC
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 519 TRASLADOINFORME Folios: 1

ASUNTO

Radicación	03-65412
Trámite	002
Evento	001
Actuación	430
Oficio	
Folios	4 ^{AN} 15923

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Vía Nacional	☐		
Vía PCT (fase nacional)	☒	Cap. I	☐
		Cap. II	☒

No. Sol. Internacional: PCT/IB01/02728
Fecha de Presentación Internal.: 31/01/2001

24 Dic 2001

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. Descripción: Folios: 141 a 549 como se radicó inicialmente.

1.2. Reivindicaciones: Reivindicaciones 1 - 10 como se radicarón inicialmente.
Folios 550 a 597.

1.3. Prioridad: Folios 17 a 140. US 60/265.486 del 31/01/2001.

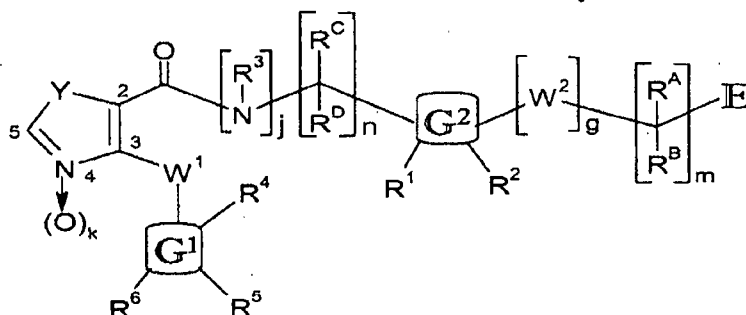
2. Objeto de la invención

- Título de la solicitud: **DERIVADOS AMIDA DE ACIDO TIAZOLILICO, OXALILICO, PIRROLILICO E IMIDAZOLILICO UTILES COMO INHIBIDORES DE LAS ISOZIMAS PDE4 .**

El objeto de la presente solicitud de patente de invención es proporcionar compuestos de fórmula 1.0.0; útiles como inhibidores de PDE4 en el

tratamiento de enfermedades reguladas por la activación y desgranulación de eosinófilos, así como el asma, bronquitis crónica y enfermedad pulmonar obstructiva.

Reivindicación 1: Un compuesto de fórmula (1.0.0).



Reivindicaciones 2 - 7: Modalidades especiales del compuesto de la reivindicación 1.

Reivindicación 8: Composición farmacéutica que contiene un compuesto de la reivindicación 1 junto con un vehículo farmacéuticamente aceptable.

Reivindicación 9: Un procedimiento de tratamiento de un sujeto que sufre una enfermedad, trastorno o afección mediada por la isozima PDE4, incluyendo el subtipo D de esta, con la cual se regula la activación y desgranulación de eosinófilos.

Reivindicación 10: Composición de un compuesto de fórmula (1.0.0) junto con un uno o más principios activos seleccionados entre otros, de inhibidores de la síntesis de leucotrienos, inhibidores de PDE4, agentes anticolinérgicos, etc.

El **problema planteado** en esta solicitud es la necesidad de compuestos y composiciones útiles como inhibidores de PDE4 para el tratamiento de enfermedades reguladas por la activación y desgranulación de eosinófilos, así como el asma, bronquitis crónica y enfermedad pulmonar obstructiva.

Para **resolver este problema** técnico, la solicitud en estudio proporciona compuestos de fórmula 1.0.0 que inhiben la fosfodiesterasa PDE4.

- *Clasificación Internacional de Patentes (IPC):* A61K31/4164; A61K31/426; A61K31/427; A61K31/433; A61K31/4439; A61P11/00; A61P11/06; C07D417/12.

3. De la solicitud de Patente

3.1. Descripción (artículo 28 D. 486)

Esta Oficina se permite señalar que los agentes terapéuticos de los folios 480 a 486, no presentan ningún estudio de actividad que demuestren su ventaja cuando se administran en combinación con los compuestos de fórmula 1.0.0; por lo tanto no se puede evidenciar la ventaja técnica comparativa que pretende el solicitante al realizar dichas combinaciones.

Por otra parte, no se describen estudios de actividad de inhibición de la enzima PDE4, lo cual no permite evidenciar la actividad declarada y las múltiples aplicaciones terapéuticas de los compuestos de fórmula 1.0.0 declaradas por el

solicitante, ni la ventaja técnica comparativa frente a otros existentes en el estado de la técnica con la misma actividad farmacológica; razones tales que no permiten evidenciar el salto inventivo pretendido por el solicitante.

3.2. Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

- **Reivindicaciones 1 - 7:** La materia objeto de protección mediante la fórmula Markush dada en estas reivindicaciones, no posee los requisitos de ser clara, concisa y de establecer un alcance definido de la invención, dado que se pueden obtener una amplia variedad de compuestos con características variables, sin que se logre denotar una característica común en los múltiples compuestos que se obtendrían mediante la sustitución de las diversas variables y radicales dados a tal fórmula. Ejemplos de lo anterior se presentan cuando:
 - j es 0, lo que indica que la posible característica de los compuestos de la invención de ser derivados amida no se cumple, ya que este grupo desaparece con el mencionado valor.
 - R^A y R^B tomados en conjunto (siendo $m = 1$) forman un resto espiro de fórmula (1.2.0); cuyo significado posee varias posibilidades, por lo tanto es muy amplio.
 - Y es $-\text{CH}(R^1a)$, siendo R^1a como se define en la reivindicación 1, lo que indica que la posible característica de los compuestos de la invención de ser derivados de amida de ácidos tiazolílico, oxalílico, pirrolílico e imidazolílico no se cumple, debido a la mencionada connotación para Y .
 - G^1 , G^2 , E pueden tomar connotaciones de un sistema carboxílico saturado o insaturado monocíclico de 3 a 7 miembros, o policíclico condensado de 7 a 12 miembros, o un resto biarilo discontinuo o limitado de 7 a 18 miembros, a excepción este último de G^1 .
 - W^1 y W^2 son $-\text{O}-$, $-\text{S}(=\text{O})$, S , $\text{S}(\text{O})_2$, NR^3 , o $-\text{CR}^{29}\text{R}^{39}-$, teniendo los R diferentes significados.

Por lo tanto, es preciso requerir al interesado que señale el verdadero alcance de su invención, pues la característica esencial de la fórmula del compuesto de la reivindicación 1 es de menor complejidad química que los compuestos obtenidos una vez se efectúan las sustituciones correspondientes pretendidas por el interesado.

- **Reivindicación 10:** La presente reivindicación no es concisa, ya que presenta una gran cantidad de posibilidades de combinaciones de otros agentes terapéuticos con los compuestos de fórmula 1.0.0, lo cual no permite evidenciar el verdadero alcance de protección de la invención.

4. Unidad de invención (artículo 25 D 486)

La característica esencial de la fórmula 1.0.0 de la reivindicación 1 genera una multitud de posibilidades de compuestos una vez realizadas las sustituciones respectivas en Y , W^1 , W^2 , G^1 , G^2 , E , R^A , R^B , R^C , R^D , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y R^6 , y dados los valores en g , j , k , m y n ; evidenciándose así la diferencia en estructura química en atención al número, clase de grupos químicos que se pueden formar y clase de átomos que conforman el anillo heterocíclico variable, la aromaticidad y el grado de saturación o insaturación de los compuestos de la reivindicación. Por lo tanto, no se puede definir de forma inequívoca un concepto inventivo que una a todas las modalidades que se pretenden proteger en el capítulo reivindicatorio. De esta manera podemos encontrar, entre otros, los siguientes grupos de compuestos y formulaciones diferentes:

- a. Compuestos y formulaciones cuando $j=1$
- b.1. Compuestos y formulaciones cuando $j=1$, $Y= S$, $k= 0$
 - b.2. Compuestos y formulaciones cuando $j=1$, $Y= S$, $k= 1$
 - b.3. Compuestos y formulaciones cuando $j=1$, $Y= O$, $k= 0$
 - b.4. Compuestos y formulaciones cuando $j=1$, $Y= O$, $k= 1$
 - b.5. Compuestos y formulaciones cuando $j=1$, $Y= N$, $k= 0$
 - b.6. Compuestos y formulaciones cuando $j=1$, $Y= N$, $k= 1$
 - b.7. Compuestos y formulaciones cuando $j=1$, $Y= SO$, $k= 0$
 - b.8. Compuestos y formulaciones cuando $j=1$, $Y= SO$, $k= 1$
 - b.9. Compuestos y formulaciones cuando $j=1$, $Y= (O=) S (=O)$, $k= 0$
 - b.10. Compuestos y formulaciones cuando $j=1$, $Y= (O=) S (=O)$, $k= 1$
 - b.11. Compuestos y formulaciones cuando $j=1$, $Y= N \rightarrow O$, $k= 0$
 - b.12. Compuestos y formulaciones cuando $j=1$, $Y= N \rightarrow O$, $k= 1$
- b. Compuestos y formulaciones teniendo en cuenta las consideraciones indicadas anteriormente, siendo $Y = CR^1a$

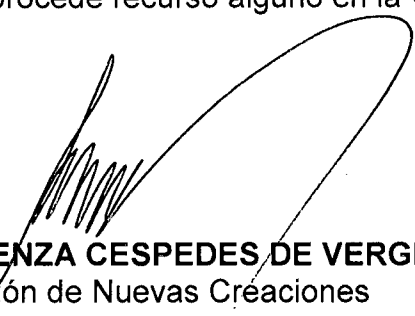
5. Excepción a la patentabilidad (artículo 20 D486 literal a)-d))

La reivindicación 9 se refiere a un procedimiento de tratamiento de un sujeto que sufre una enfermedad, trastorno o afección mediada por la isozima PDE4. Por lo tanto, debido a que su contenido se refiere a un método de tratamiento o terapéutico, no es patentable.

6. Conclusión:

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 artículo 8 de la resolución reglamentaria No. 00210 del 15 de enero de 2001, advirtiéndole que contra él no procede recurso alguno en la vía gubernativa.


ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Jefe de División de Nuevas Creaciones

El anterior, requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 07 DIC. 2001.

CONCEPTO TECNICO No. 2142

EXAMINADOR TECNICO
Código No.202071