

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.

Abogado
LUIS PATIÑO LEYVA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 03-077714- -00008-0000

Fecha: 2009-10-08 13:57:36 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 519 TRASLADOINFORME Folios: 1

ASUNTO	Radicación	03-77714
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	430
	Oficio	11327
	Folios	006

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Via Nacional	☐		
Vía PCT (fase nacional)	☒	Cap.I	☐
		Cap. II	☒
No. Sol. Internacional	<u>PCT/EP02/01917</u>		
Fecha de Presentación Internal.	<u>23/02/2002</u>		

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

<u>Descripción:</u>	Folios <u>57-132</u> como se radicó inicialmente
<u>Reivindicaciones:</u>	Folios <u>133-136</u> como se radicó inicialmente
	Folios <u>216-218</u> como se radicó el 15-09-2009
<u>Prioridad:</u>	Folio <u>1</u> DE, 10111877.5, 10-03-2001.
<u>Respuesta del solicitante</u>	Folios <u>207-213</u> como se radicó el 15-09-2009

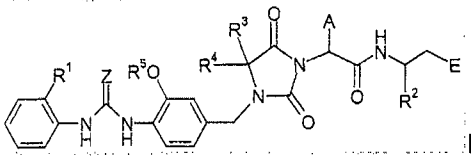
2. Objeto de la invención

Título de la solicitud: DERIVADOS DE IMIDAZOLINA, SU PREPARACION, SU USO Y PREPARACIONES FARMACEUTICAS QUE LOS CONTIENEN (folio 1).

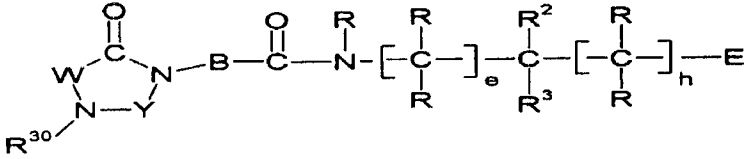
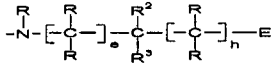
El problema técnico planteado en esta solicitud esta relacionado con la necesidad de obtener nuevos compuestos derivados de imidazolina como inhibidores de la adhesión y migración de leucocitos y/o antagonistas del receptor de adhesión VLA-4 (receptor de integrina β -1), que sean útiles en el tratamiento de estados inflamatorios crónicos como artritis reumatoide, asma, enfermedad del intestino delgado, lupus eritematosos sistémico, alergias de tipo retardado, entre otros (folio 57-63; pág. 1-7).

SOLICITUD

Un compuesto de formula I



Con radicales R¹-R⁵ y variables Z, A y E según reivindicación 1.

D1					
					
I (folio 192, pág. 162)					
R^{30} : R^{32} -(R)N-CO-N(R)- R^{31} - R^{32} -(R)N-CS-N(R)- R^{31} . (folio 198, pág. 181)		W : R^1 -A-C(R^{13}) (folio 192, pág. 162)	Y : C=O (folio 192; pág. 162) B : alquileneC ₁₋₆ opc. sust. por alquiloC ₁₋₆ ó cicloalquilC ₃₋₆ alquiloC ₁₋₂ . (folios 193, 199; pág. 163, 182)	 : e:0 y h:1 -NH-CH(R^3)-CH2-E (folio 191, 199; pág.60,182)	
R : H R^{32} : fenilo opc. sustituido por alquiloC ₁₋₄ (folios 185,197, 199, pág. 17,167,182)	R^{31} :(1,4-fenilene)-CH2- Donde el fenilo es preferiblemente sustituido, por sustituyentes como OH ó alcoxiC ₁₋₄ (folios 185,197,199, 219; pág. 17, 58, 167, 182)	A: enlace R^1 :alquiloC ₁₋₁₀ opc. mono o polisust.por F R^{13} : alquiloC ₁₋₁₀ opc. mono o polisust.por F (folios 193,196; pág. 163,166)	R^3 : • alquiloC ₁₋₁₀ opc. mono o polisust.por F. • ariloC ₆₋₁₄ opc. sustituido, por alquiloC ₁₋₁₄ , alcoxiC ₁₋₄ , -CF ₃ , -OCF ₃ , halo, metilendioxi, etilendioxi, heteroarilo (como piridilo) opc. sust. (folio 194, 185; pág. 164,17)	E : -COR ¹⁰ -COH -CH ₂ .OR ⁸ R^8 : H, alquiloC ₁₋₁₀ R^{10} : OH, alcoxiC ₁₋₁₀ , arilC ₆₋₁₄ alcoxiC ₁₋₆ , arilC ₆₋₁₄ oxi, alquilC ₁₋₆ (CO)-O-alcoxiC ₁₋₆ , arilC ₆₋₁₄ (CO)-O-alcoxiC ₁₋₆ , arilC ₆₋₁₄ alquilC ₁₋₆ (CO)-O-alcoxiC ₁₋₆ , alcoxiC ₁₋₆ (CO)-O-alcoxiC ₁₋₆ , arilC ₆₋₁₄ oxi(CO)-O-alcoxiC ₁₋₆ , arilC ₆₋₁₄ alcoxiC ₁₋₆ (CO)-O-alcoxiC ₁₋₆ , amino, mono o di(alquilC ₁₋₁₀)amino. (folios 193,195,196; pág. 163,165,166)	

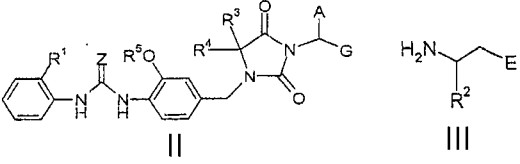
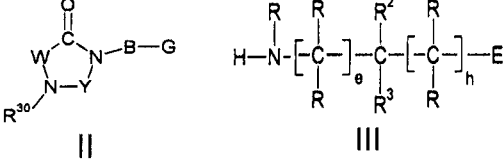
Que D1 (folios 185-199 y 219; pág. 17, 18, 20, 58, 60,162-182) divulga compuestos de formula I, que incluyen los compuestos reclamados bajo la fórmula I de la solicitud, tal como se expone en el cuadro comparativo. Adicionalmente, D1 divulga composiciones farmacéuticas que contienen uno o más de los compuestos de formula I o sus sales tolerables y excipientes farmacéuticamente adecuados (folio 200; pág. 183).

En consecuencia, dichos compuestos reclamados y las composiciones farmacéuticas que los contienen, se encuentran ya cubiertos por el alcance de D1 y no son nuevos.

➤ Proceso

Se solicita en la reivindicación 9, un procedimiento para preparar compuestos de formula I:

Al comparar el proceso reivindicado con el estado de la técnica esta Oficina encuentra:

SOLICITUD	D1
Procedimiento para preparación de compuestos de fórmula I, caracterizado por: la reacción entre un compuesto de fórmula II y un compuesto de fórmula III:  Donde A, Z, E y R¹-R⁵ son según reivindicación 1, o hay grupos funcionales en forma protegida o en forma de precursores, y donde G es hidroxicarbonilo, alcoxiC₁₋₆carbonilo o derivados de ácido carboxílico activados.	Proceso para la preparación de compuestos de fórmula I, que comprende: la reacción de un compuestos de fórmula II con un compuesto de fórmula III:  Donde W, Y, B, E, R₂, R₃ y R₃₀, así como e y h son según reivindicación 1, o alternativamente existen grupos funcionales en forma protegida o en forma de precursores, y donde G es hidroxicarbonilo, alcoxiC₁₋₆carbonilo o derivados de ácido carboxílico activados (folios 199-200; pág. 182-183).

Que el proceso solicitado es ya divulgado por D1 (folios 199-200, pág. 182-183), tal como se enseña en el cuadro comparativo, para la preparación de compuestos de fórmula I; por lo que tal proceso no es nuevo.

5. Respuesta al solicitante

El solicitante anexa un nuevo capítulo reivindicatorio (folios 216-218) en el que ha eliminado las reivindicaciones que caracterizaban un compuesto por su uso y en la reivindicación de proceso ha corregido la estructura del compuesto de fórmula II, acorde a las objeciones de claridad realizadas. Capítulo reivindicatorio que es aceptado por la Oficina.

- En cuanto a la afectación por novedad el solicitante señala que:
- a) La invención de la solicitud corresponde a una selección específica de compuestos no anticipada por D1, pues este documento no menciona explícita o implícitamente las posibilidades de sustitución de la solicitud, ... resaltando que la diferencia estructural está en que el sustituyente -OR⁵ de la solicitud es un H en D1...y que D1 no anticipa este reemplazo para introducir específicamente el sustituyente -OR⁵ en los compuestos de D1 (folio 208; pág. 2 de respuesta).

Al respecto, se señala primero, que tal como lo indica el solicitante el compuesto de fórmula I solicitado es una selección del compuesto de fórmula I de D1, por lo que la materia reivindicada se encuentra dentro del alcance de D1 y no es nueva.

Segundo, que D1 que señala que una serie de compuestos de fórmula I especialmente preferidos son aquellos donde el fenilo central está sustituido (folio 219; pág. 58, lín. 30) e indica que los sustituyentes pueden ser por OH o alcoxiC₁₋₄ (folio 185-186 ; pág. 17-18), siendo así igual al fenilo sustituido por -OR⁵ (R⁵:H ó alquiloC₁₋₄) del compuesto de fórmula I de la solicitud; lo que confirma que no hay diferencia entre la solicitud y D1 y que la materia reclamada no es nueva al estar ya incluida en D1.

- b) El solicitante menciona que si bien no se objetó la altura inventiva de los compuestos reivindicados, desea demostrar el efecto mejorado de los compuestos de la invención gracias al patrón de sustitución que los diferencia de

D1, para resaltar que la persona versada en la materia no derivó de D1 los compuestos solicitados (folios 209-212; pág. 3-6).

Cabe aclarar que si el requisito de novedad no se cumple el nivel inventivo no es evaluado, porque se estaría evaluando nuevamente el nivel inventivo de compuestos que ya se conocen tienen la actividad señalada y cuyo valor específico simplemente se estaría determinando, puesto que dicha actividad y su valor son propiedades intrínsecas de los compuestos ya incluidos en D1.

Adicionalmente, el solicitante señala datos comparativos de actividad de compuestos de fórmula I de la invención (con -OR⁵; 2.1 nM, 0.3 nM, 0.6 nM, 1.8 nM y 0.9 nM) y de compuestos de fórmula I de D1 (con H en lugar de -OR⁵; 30nM, 3.8 nM, 5 nM, 2.5 nM, 1.5 nM y 3 nM), concluyendo que los de la selección de la solicitud tienen una actividad biológica mayor que los de D1 (folio 210-211; pág. 4-5).

No obstante y teniendo presente que los compuestos de la solicitud no son nuevos, se aclara que D1 divulga que dentro de los compuestos de fórmula I existen compuestos que poseen actividades del mismo orden de los compuestos de la selección de la solicitud, tales como 1.5 nM, 2.5 nM, 3nM, 0.85nM, 2.3nM, 1.6nM (ej. 17, 7, 19, 47, 67, 188 respectivamente; folios 220-221; pág. 157-158), lo que indica a un experto en la materia que los de la selección de la solicitud son compuestos alternativos dentro del grupo ya conocido de compuestos de fórmula I de D1, sin que sean una ventaja dentro de la materia conocida o no nueva.

- c) Los compuestos ejemplificados por D1 no tienen el sustituyente -OR⁵ de la solicitud y el efecto sorprendente de la actividad inhibitoria de los compuestos reivindicados no había sido descrito en el estado de la técnica (folio 212; pág. 6 de respuesta).

En relación a lo anterior, se aclara que aunque los compuestos ejemplificados por D1 no posean el sustituyente -OR⁵, este sustituyente ya está indicado en D1 para el compuesto de fórmula I como se explicó en el punto a) y que el hecho que no se encuentre descrita en D1 el valor de actividad inhibitoria de los compuestos reivindicados (con-OR⁵) no los hace nuevos, pues sencillamente se determinó el valor de la actividad (propiedad inherente) ya señalada por D1 para una selección de compuestos que están dentro del alcance de D1.

- d) El solicitante reconoce la autonomía de este Despacho en la evaluación de solicitudes de patente y solicita que se tenga en cuenta el examen preliminar internacional (que establece que la solicitud es una selección nueva por señalar el radical -OR⁵ en vez de H) e informa que esta solicitud ya ha sido concedida en Europa, Estados Unidos y Australia (folio 213; pág. 7 de respuesta).

En referencia a lo anterior y acorde con el reconocimiento del solicitante se reitera que esta Oficina tiene autonomía para tomar una decisión acorde con el propio análisis de patentabilidad realizado.

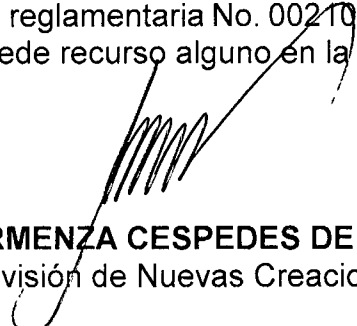
6. Conclusión

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

N°	Documento N°	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	CA2254420	1-10	Novedad

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
_____ **09 OCT. 2009**

CONCEPTO TECNICO No. 3390	EXAMINADOR TECNICO Código No. 202079
-------------------------------------	--