

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO			
RAD: 11-161736- -7	DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	FECHA: 2013-06-05 13:25:37	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	ACT: 519 PRESENTACION	FOLIOS: 5	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
CARLOS ORLANDO MAYA RODRIGUEZ

Asunto: Radicación: 11-161736- -7
 Trámite: 11
 Evento: 378
 Actuación: 519
 Oficio: 10005
 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/US2010/036211				
Fecha de Presentación Internacional	26/05/2010				

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 24 a 89	25/Noviembre/2011
	Folios 95 a 205	25/Noviembre/2011
Reivindicaciones:	Folios 90 a 93	25/Noviembre/2011
	Folios 206 a 212	25/Noviembre/2011
	Folios 255 a 259	25/Noviembre/2011
Dibujos:	Folios 24 a 89	25/Noviembre/2011
	Folios 95 a 205	25/Noviembre/2011
Prioridad:	US 61 181 376	28/Mayo/2009

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.

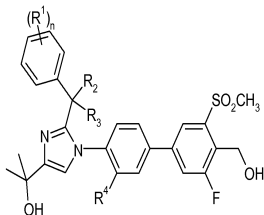
3. Objeto de la invención

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 ésta solicitud el solicitante presenta diez (10) reivindicaciones, las cuales están cubiertas por tasa del examen de patentabilidad. Por anterior se estudiarán las reivindicaciones 1 a 10.

Título de la solicitud: “Moduladores del LXR”

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar compuestos imidazólicos que son útiles como moduladores de la actividad de los receptores hepáticos X(LXR) en los trastornos asociados al metabolismo del colesterol.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de la fórmula (I) y composiciones que lo contienen, caracterizado por tener un anillo imadazol, y un halógeno (flour), junto con otros grupos funcionales presentados en los folios 255 a 259.



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K 31/4164

4. Excepción a la Patentabilidad (Art 20 D 486 literal (d))

El objeto de las reivindicaciones 11 – 15 no es patentable de acuerdo con el Art citado.

5. De la solicitud de patente

Titulo

El título no corresponde con el objeto de la solicitud porque es muy general, se sugiere ajustarlo a la materia que se reclama teniendo en cuenta los compuestos reclamados y soportados en la descripción.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

Las reivindicaciones 4, 5, 6, 7, 8 y 9 no concisas porque comparten materia, de acuerdo a lo presentado en la tabla 1.

Tabla 1. Materia compartida por las reivindicaciones 4,5, 6, 7 y 8

Rv4. No 3: 2-(1-(3-cloro-3´-fluoro-4´-(hidroximetil)-5´-(metilsulfonil)bifenil-4-il)-2-(2-(2,6-diclorofenil)propan-2-il)-1H-imidazol-4-il)propan-2-ol	Rv 5. 2-(1-(3-cloro-3´-fluoro-4´-(hidroximetil)-5´-(metilsulfonil)bifenil-4-il)-2-(2-(2,6-diclorofenil)propan-2-il)-1H-imidazol-4-il)propan-2-ol
Rv4 No 4:	Rv 6.

2-(2-(2-(2-cloro-3-fluorofenil)propan-2-il)-1-(3'-fluoro-4'-(hidroximetil)-5'-(metilsulfonil)bifenil-4-il)-1H-imidazol-4-il)propan-2-ol	2-(2-(2-(2-cloro-3-fluorofenil)propan-2-il)-1-(3'-fluoro-4'-(hidroximetil)-5'-(metilsulfonil)bifenil-4-il)-1H-imidazol-4-il)propan-2-ol
Rv4 No 5: 2-(2-(2-(2,6-diclorofenil)propan-2-il)-1-(3'-fluoro-4'-(hidroximetil)-5'-(metilsulfonil)bifenil-4-il)-1H-imidazol-4-il)propan-2-ol	Rv 7. 2-(2-(2-(2,6-diclorofenil)propan-2-il)-1-(3'-fluoro-4'-(hidroximetil)-5'-(metilsulfonil)bifenil-4-il)-1H-imidazol-4-il)propan-2-ol
Rv4 No 9: 2-(2-(2-(2,6-diclorofenil)propan-2-il)-1-(3,3'-difluoro-4'-(hidroximetil)-5'-(metilsulfonil)bifenil-4-il)-1H-imidazol-4-il)propan-2-ol	Rv 8. 2-(2-(2-(2,6-diclorofenil)propan-2-il)-1-(3,3'-difluoro-4'-(hidroximetil)-5'-(metilsulfonil)bifenil-4-il)-1H-imidazol-4-il)propan-2-ol
Rv4 No 21: 2-(2-(1-(2,6-diclorofenil)etil)-1-(3,3'-difluoro-4'-(hidroximetil)-5'-(metilsulfonil)bifenil-4-il)-1H-imidazol-4-il)propan-2-ol	Rv 9. 2-(2-(1-(2,6-diclorofenil)etil)-1-(3,3'-difluoro-4'-(hidroximetil)-5'-(metilsulfonil)bifenil-4-il)-1H-imidazol-4-il)propan-2-ol

La reivindicación 10 no está sustentada en la descripción porque la composición que reclamada, está en la reivindicación y no en la descripción. 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.

6. 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, mayo 28 de 2009. 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 2007/002563	"Imidazole based LXR Modulators"	04/Enero/2007
D2	WO 2008/073825	"LRX and FRX Modulators"	19/Junio/2008

El documento D1⁽¹⁾ divulga compuestos que modulan la actividad de los LXR (Pág. 1, líneas 6-10), y de manera específica el compuesto (18) 2-(2-(5-cloro-2-(trifluorometil)bencil)-1-(4'-(hidroximetil)-3'-(metilsulfonil)bifenil-4-il)-1H-imidazol-4-il)propan-2-ol, (Pág. 194, Ej. 18) que demuestra la capacidad de modular la actividad de los LXR, y el cual presenta un EC50 < 1µM (Pág. 230. Ej. 18).

El documento D2⁽²⁾ divulga compuestos que modulan la actividad de los receptores X de los LXR (Pág. 1, Párr. 002). En particular isómeros y derivados pirazoles e imidazoles están asociados como moduladores LXR.

1. [http://patentscope.wipo.int/search/en/detail.jsf?docId=WO2007002563&recNum=1&docAn=US2006024757&queryString=FP:\(WO2007002563\)&maxRec=1](http://patentscope.wipo.int/search/en/detail.jsf?docId=WO2007002563&recNum=1&docAn=US2006024757&queryString=FP:(WO2007002563)&maxRec=1)

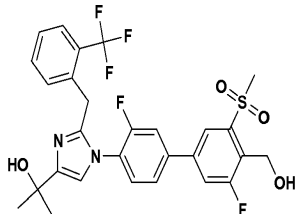
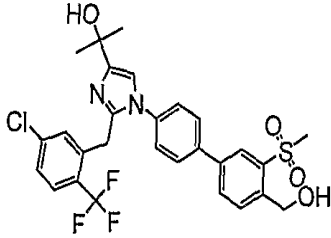
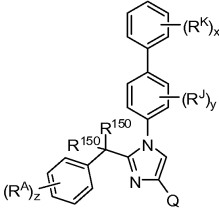
2. [http://patentscope.wipo.int/search/en/detail.jsf?docId=WO2008073825&recNum=1&docAn=US2007086787&queryString=FP:\(WO%202008073825\)&maxRec=1](http://patentscope.wipo.int/search/en/detail.jsf?docId=WO2008073825&recNum=1&docAn=US2007086787&queryString=FP:(WO%202008073825)&maxRec=1)

7 . Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en compuestos seleccionados como por ejemplo el compuesto (12) el cual es 2-(1-(3´-fluoro-4´-(hidroximetil)-5´-(metilsulfonil)bifenil-4-il)-2-(2-(2-fluorofenil)propan-2-il)-1H-imidazol-4-il)propan-2-ol (Folio 255).

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

Características esenciales	D1	D2
(12) 2-(1-(3,3´-difluoruro-4´-(hidroximetil)-5´-(metilsulfonil)bifenil-4-il)-2-(2-trifluorometil)bencil)-1H-imidazol-4-il)propan-2-ol  (Folio 170)	(18) 2-(2-(5-cloro-2-(trifluorometil)bencil)-1-(4´-(hidroximetil)-3´-(metilsulfonil)bifenil-4-il)-1H-imidazol-4-il)propan-2-ol  (Pág. 194, Ej. 18)	Un compuesto de fórmula general:  (Pág. 342, compuesto de la reivindicación 5) Dónde: x= 0, 1, 2, 3 y 4 y= 0, 1, 2 y 3 z= 0, 1, 2, 3 y 4 (Pág. 342, reivindicación 5) (RA)z= haloalquilo C1-6 (Pág. 339, líneas 5-8), preferiblemente trifluorometil (Pág. 105, línea 12) R150= alquilo C1-6 (Pág. 341, línea 10), preferiblemente metil (Pág. 104, línea 11) Q= arilo o heteroarilo (Pág. 343, líneas 11-12) Rj= halógeno (Pág. 342, reivindicación 5), preferiblemente flúor (Pág. 106, línea 10) Rk= halógeno, -OR110, -SO2R110 (Pág. 350, línea 4); preferiblemente: Halógeno= flúor (Pág. 106, línea 10), R110= hidrógeno (Pág. 343, línea 28)

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 el compuesto (18) 2-(2-(5-cloro-2-(trifluorometil)bencil)-1-(4'-(hidroximetil)-3'-(metilsulfonil)bifenil-4-il)-1H-imidazol-4-il)propan-2-ol, (Pág. 194, Ej. 18) que demuestra la capacidad de modular la actividad de los LXR, y el cual presenta un $EC_{50} < 1\mu M$ (Pág. 230, Ej. 18). El documento D2 define compuestos de fórmula general substituidos (Pág. 342, compuesto de la reivindicación 5)

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1 compuesto (12) y el compuesto definido en el documento D1, consiste en que el compuesto reivindicado presenta un átomo de fluoruro en la posición meta del grupo fenilsulfonilo y el compuesto (18) definido en el documento D1 carece de éste átomo de fluoruro en dicha posición.

El efecto técnico de incluir un átomo de fluoruro en la posición meta del grupo fenilsulfonilo consiste en aumentar la modulación de la actividad de los receptores hepáticos X (LRX)

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo proveer compuestos que permitan aumentar la modulación de la actividad de los receptores hepáticos X (LRX)”.

Sin embargo, aunque el compuesto (18) del documento D1 carece del átomo de fluoruro en la posición meta del grupo fenilsulfonilo, el documento D2 divulga que en la misma posición existe el radical Rk, el cual puede tener hasta 4 radicales en el anillo aromático, entre los cuales están: halógeno, -OR110, -SO2R110 (Pág. 350, línea 4); preferiblemente: el halógeno es flúor (Pág. 106, línea 10), R110 es hidrógeno (Pág. 343, línea 28) los cuales corresponden a: flúor, SO2CH3 y OH.

Es importante mencionar que en la descripción se presentan resultados de la actividad moduladora de los compuestos reclamados y en detalle del compuesto (12) 2-(1-(3,3'-difluoruro-4'-(hidroximetil)-5'-(metilsulfonil)bifenil-4-il)-2-(2-trifluorometil)bencil)-1H-imidazol-4-il)propan-2-ol (Fl. 255) ea cual define una actividad $EC_{50} \leq 100 \text{ nM}$ (0,1 μM) (Fl. 194). Esta actividad es comparable con la presentada por el compuesto 18 definido en el documento D1 ($EC_{50} < 1\mu M$ (Pág. 230. Ej. 18)).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría los significados del radical Rk, el cual puede tener hasta 4 radicales en el anillo aromático, entre los cuales están: halógeno, -OR110, -SO2R110 (Pág. 350, línea 4); preferiblemente: el halógeno es flúor (Pág. 106, línea 10), R110 es hidrógeno (Pág. 343, línea 28) los cuales corresponden a: flúor, SO2CH3 y OH, divulgados en los compuestos del documento D2, en el compuesto definido en el documento D1 para llegar así a los compuestos de la solicitud, como lo es el No. 12. Por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2-9 no mencionan compuestos inventivos adicionales, tampoco se pueden considerar inventivas.

8. Conclusión

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

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO 2007/002563	1-10	Nivel Inventivo
D2	WO 2008/073825	1-10	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