

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 12-14916- -2	FECHA: 2014-02-14 14:39:27
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 10
ACT: 519 PRESENTACION	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO

Asunto: Radicación: 12-14916- -2
 Trámite: 11
 Evento: 378
 Actuación: 519
 Oficio: 1998
 Folios: 10

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/JP2010/062037				
Fecha de Presentación Internacional	16/07/2010				

1. Documentos estudiados

Descripción:	Radicación 12-14916-00000	31/Enero/2012
Reivindicaciones:	Radicación 12-14916-00000	31/Enero/2012
Prioridad(es):	JP2009-169565	17/Julio/2009
	US61/273.127	30/Julio/2009

2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de prioridad porque su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada (Art. 9 D 486) y fue presentada dentro del plazo establecido por la D. 486.

3. Objeto de la invención

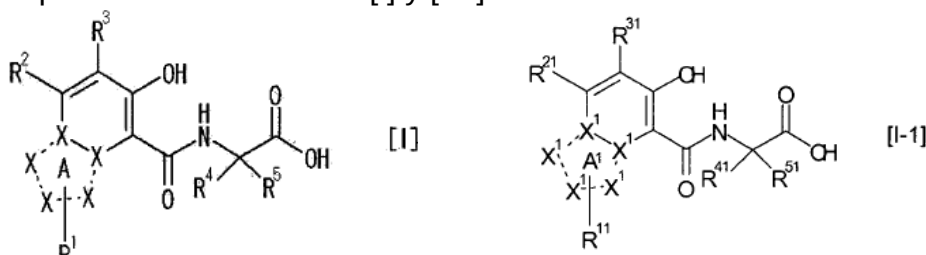
De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del Título X de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por el solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es que cuando la solicitud contenga más de diez (10) reivindicaciones y no se haya pagado la tasa complementaria, sólo se estudiarán las

cubiertas por la tasa pagada. En el presente caso se estudiarán las reivindicaciones 1 a 40 del capítulo reivindicatorio.

Título de la solicitud: “Compuesto triazolopiridina, y su acción como inhibidor de prolil hidroxilasa e inductor de la producción de eritropoyetina”.

El problema planteado en esta solicitud consiste en diseñar compuestos para inhibir la acción de la enzima prolil-hidroxilasa y de inducir la producción de eritropoyetina (EPO).

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de las fórmulas [I] y [I-1].



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D471/04, A61K31/437, A61P7/06, A61P43/00.

4. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso (Art 14 y 21 D 486)

El uso de las reivindicaciones 31 a 34 no es patentable, de acuerdo con el Art 14.

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

El método definido en las reivindicaciones 1 a 38 no es patentable, de acuerdo con el Art. 20 literal d).

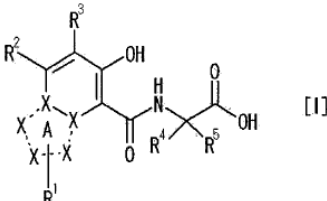
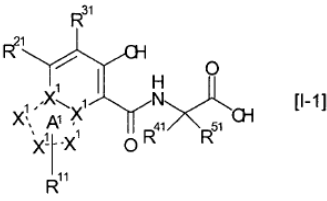
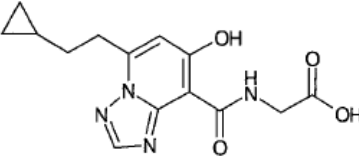
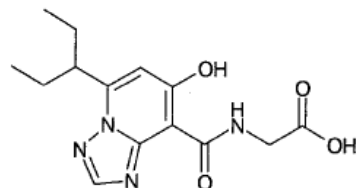
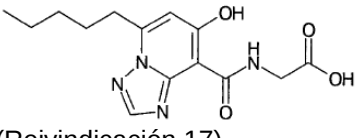
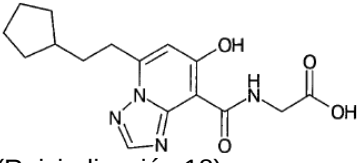
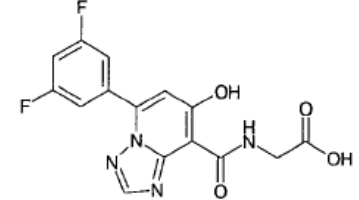
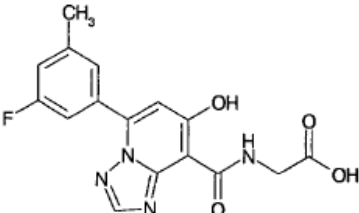
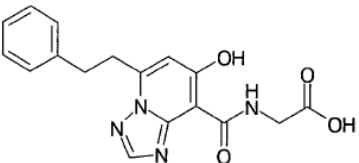
6. De la solicitud de patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

Las reivindicaciones 27 a 30 se encabezan en la forma de la función de los compuestos como inhibidores de la prolil hidroxilasa o como agente terapéutico que induce la producción de eritropoyetina y se caracterizan en términos de las sales o solvatos farmacéuticamente aceptables que pueden llegar a formar los compuestos de fórmula [I]. Dichas reivindicaciones presentan faltan de concisión porque repiten de manera innecesaria la información correspondiente a la posibilidad de que los compuestos de fórmula [I] formen sales, por lo anterior, se sugiere a la solicitante eliminarlas las reivindicaciones redundantes.

Las reivindicaciones 1, 9, 13, 14 definen los radicales R^1 , R^2 , R^3 , R^{11} , R^{21} , R^{31} y al grupo B en términos funcionales o por géneros sin que exista una divulgación que permita ejemplificar todas las posibles modalidades que se derivan de dicha definición:

Tabla 1.

Radicales definidos en las reivindicaciones		Ejemplificados en la divulgación y reivindicaciones
 [I]	 [I-1]	
R¹	(3) un grupo arilo C6-14 (4) un grupo cicloalquilo C3-8 (5) un grupo arilo C6-14-alquilo C1-6 (6) un grupo cicloalquil C3-8-alquilo C1-6 (reivindicación 1)	 (Reivindicación 15)
R²	(3) un grupo arilo C6-14 (4) un grupo cicloalquilo C3-8 (5) un grupo cicloalquenilo C3-8 (6) un grupo heteroarilo donde heteroarilo tiene además de los átomos de carbono, 1 a 6 heteroátomos seleccionados de N, O, S (7) un grupo aril C6-14-alquilo C1-6 (8) un grupo cicloalquilo C3-8-alquilo C1-6 (reivindicaciones 1, 9 y 13)	 (Reivindicación 16)
R³	(4) un grupo arilo C6-14 (5) un grupo cicloalquilo c3-8 (6) un grupo arilo C6-4-alquilo C1-6 (reivindicación 1)	 (Reivindicación 17)
Grupo B	(c) un grupo cicloalquilo C3-8 (reivindicaciones 1 y 14)	 (Reivindicación 18)
R¹¹	(4) un grupo cicloalquilo C3-8 (6) un grupo cicloalquil C3-8 alquilo C1-6 (reivindicación 14)	 (Reivindicación 19)
R²¹	(4) un grupo cicloalquilo C3-8 (5) un grupo cicloalquenilo C3-8 (6) un grupo cicloalquil C3-8 alquilo C1-6 (reivindicación 14)	 (Reivindicación 20)
R³¹	(5) un grupo cicloalquilo C3-8	

	(Reivindicación 25)
--	---------------------

Se invita al solicitante a presentar una razonable generalización de los radicales que han sido probados y ejemplificados, tanto en las reivindicaciones dependientes que definen los compuestos por fórmula estructural, como de aquellos que en efecto han sido sintetizados y forman parte de la divulgación de la invención.

El kit definido en la reivindicación 40 se caracteriza en términos de la composición farmacéutica y el prospecto con las indicaciones para el tratamiento o profilaxis de la anemia. Se recuerda a la solicitante que una invención de combinación encabezada en términos de kit-de-partes corresponde a la combinación nueva a inventiva de dos o más agentes farmacológicamente activos, por lo que tal y como se encuentra presentada la reivindicación 40 se refiere a las instrucciones de administración del compuesto contenido en las formulaciones farmacéuticas, con lo cual se asemeja más a un método de tratamiento que a un producto, por lo que se sugiere retirar dicha reclamación del capítulo reivindicatorio.

7. Unidad de invención (Art 25 D 486)

La solicitud no cumple con el requisito de unidad de invención porque se refiere a dos grupos inventivos.

Los grupos inventivos están definidos por las siguientes características esenciales:

Grupo inventivo 1. Los compuestos definidos en las reivindicaciones 1 a 30, de la fórmula [I].

Grupo inventivo 2. Un envase comercial que comprende la composición farmacéutica y un prospecto asociado con el mismo para el tratamiento profilaxis de la anemia, de acuerdo con la reivindicación 39. Este grupo inventivo no presenta soporte técnico en la memoria descriptiva de la solicitud.

Los grupos inventivos no comparten elementos técnicos particulares, como quiera que los compuestos forman parte de una unidad estructural caracterizada por la fórmula [I], mientras que en el caso del envase no se define su estructura y/o disposición de los materiales y por otra parte, pertenecen a campos técnicos diferentes.

Se sugiere presentar las solicitudes divisionales que considere necesarias, o limitar la solicitud inicial a una sola invención, eliminando de ella las otras invenciones.

8. Determinación del Estado de la Técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la prioridad reivindicada: Julio 17 de 2009 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud.

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2008107125	"New 3-([1,2,4]triazolo[4,3-a]pyridine-7-il)benzamide derivatives"	12/Septiembre/2008

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D2	WO2007136990	"Prolyl hydroxylase inhibitors"	29/Noviembre/2007

El documento D1¹ divulga inhibidores de la protein-quinasa P38 que presentan actividad como antianémicos (Pág. 3, línea 31) cuya estructura anular es de 3-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-7-il)benzamida (Págs. 1, 90 y 91). Resumen.

El documento D2² divulga compuestos de fórmula (I) que presentan actividad antagonista de HIF prolil-hidroxilasas para el tratamiento de anemia. (Resumen)

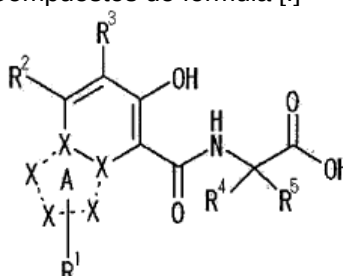
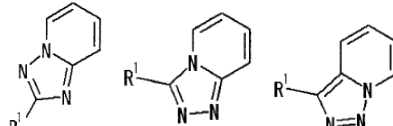
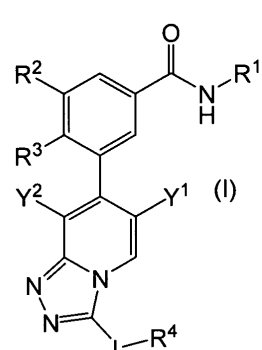
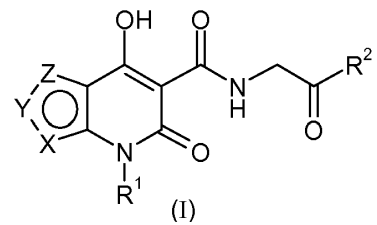
9. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel Inventivo (Art 18 D 486)

La reivindicación 1 consiste en un compuesto caracterizado porque es de fórmula [I].

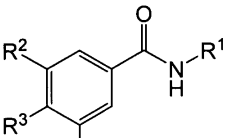
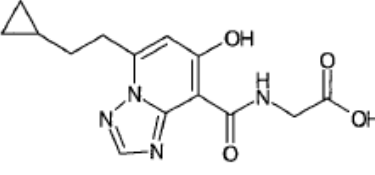
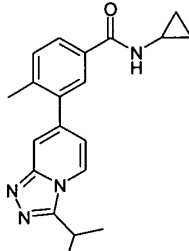
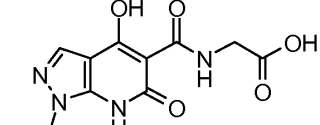
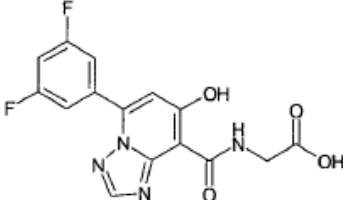
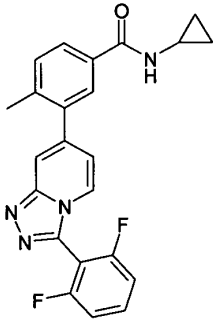
Tabla 3.

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

Características esenciales	D1	D2
Compuestos de fórmula [I]  [I] Donde el anillo fusionado es  Posición 7 del anillo fusionado -OH	Compuestos de fórmula (I) (Reivindicaciones, Págs. 90 a 95)  (I) Y¹ es -H o halógeno	Compuestos de fórmula (I) (Reivindicaciones, Pág. 22)  (I) Donde: Z-Y-X forman un anillo heterocíclico aromático de 5 miembros que incluyen un CR9, O, N, NR10 o S
R¹ es (1) -H, (2) alquilo C1-6, (3) arilo C6-14, (4) cicloalquilo C3-8, (5) arilo C6-14-alquilo C1-6, (6) cicloalquilo C3-8-alquilo C1-6	L-R⁴ donde L es un enlace, -(CRaRb)(1-2)-, -CO-, -S-, -O-, -(CRaRb)(0-2)-NH-CO-, -CO-NH-(CRaRb)(0-1)- y R⁴ es -H, OH, alcoxi C1-4, alquilo C1-4, cicloalquil C3-6, aril C5-14, heterociclo de 3 a 7 miembros con N, O	R9 es H, NO2, CN, halógeno, alquilo C1-10, arilo o heteroarilo.

1 [http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2008107125A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20080912&DB=EPODOC&locale=en_EP)

2 [http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20071129&CC=WO&NR=2007136990A2&KC=A2)

Características esenciales	D1	D2
	y S.	
(Posición 5) R ² es (1) –H, (2) alquilo C1-10, (3) un grupo arilo C6-14 opcionalmente sustituido con los mismos o diferentes 1 a 5 sustituyentes seleccionados del grupo B, (4) cicloalquilo C3-8, (5) cicloalqueno C3-8, (6) heteroarilo, (7) arilo C6-14-alquilo C1-6, (8) cicloalquil C3-8-alquilo C1-6.	Y ² es –H o halógeno	-
(Posición 6) R ³ es (1) –H, (2) halógeno, (3) alquilo C1-6, (4) arilo C6-14, (5) cicloalquilo C3-8 o (6) aril C6-14-alquilo C1-6.		-OH
R ⁴ y R ⁵ es (1) halógeno, (2) alquilo C1-6	No menciona	R1 es –H, alquilo C1-10 y R2 es –NR6R7 o bien –OR8
Grupo B es (a) halógeno, (b) alquilo C1-6, (c) cicloalquilo C3-8, d) CN y e) alquilo C1-6	No menciona	
Clorhidrato del ácido {[5-(2-ciclopropiletil)-7-hidroxi[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-8-carbonil]amino}acético 	N-ciclopropil-3-(3-isopropil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-7-il)-4-metilbenzamida  (Ejemplo 2, Págs. 58 y 59)	N-[(4-hidroxi-6-oxo-1-fenil-6,7-dihidro-1H-pirazolo[3,4-b]piridin-5-il)carbonil]glicina  (Ejemplo 6, Pág. 18)
Clorhidrato del ácido (R)-2-[[5-(3,5-difluorofenil)-7-hidroxi[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-8-carbonil]amino}propiónico 	N-ciclopropil-3-[3-(2,6-difluorofenil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-7-il]-4-metilbenzamida  (Ejemplo 12, Págs. 63 y 64)	-

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga inhibidores de la protein-quinasa P38 con actividad antianémica (Pág. 3, línea 31), cuya estructura anular es de 3-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-7-il)benzamidias (Págs. 1, 90 y 91, Resumen).

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1 y las enseñanzas del documento D1 consiste en la presencia del sustituyente ácido-carbamoil-alquil-carboxílico sobre la posición 8 del anillo fusionado de 7-hidroxi[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina.

El efecto técnico que se origina al diseñar 7-hidroxi[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridinas sustituidas por ácido-carbamoil-alquil-carboxílico sobre la posición 8 consiste en obtener alternativas terapéuticas para inhibir la prolil hidroxilasa (PHD) humana y modular la producción de eritropoyetina (EPO) humana.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver la invención consiste en: cómo diseñar inhibidores de PHD humana alternativos a los conocidos.

Sin embargo, el documento D2 divulga compuestos de fórmula (I) que presentan actividad antagonista de HIF prolil-hidroxilasas para el tratamiento de anemia. (Resumen). Específicamente, el documento D2 menciona pirazolo[3,4-b]piridinas que presentan un sustituyente tipo ácido-carbamoil-alquil-carboxílico sobre la posición 5 del anillo fusionado según el ejemplo 6 (Pág. 18). En este documento se divulga que los compuestos presentan valores de EC50 en el rango comprendido entre 1 y 20µM (Pág. 21, líneas 20 a 25).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia contaba con la sugerencia o motivación razonable para diseñar compuestos alternativos que conserven el núcleo de 7-hidroxi[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridinas como lo divulga el documento D1, y de introducir grupos ácido-carbamoil-alquil-carboxílico como sustituyentes del anillo fusionado como lo divulga el documento D2 para inhibir la prolil-hidroxilasa humana (PHD), por lo cual, la reivindicación 1 se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones 2 a 13 no divulgan elementos característicos adicionales, se considera que dichas reivindicaciones tampoco cumplen con el requisito de nivel inventivo.

La reivindicación 14 consiste en un compuesto caracterizado porque es de fórmula (I-1).

Tabla 4.

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

Características esenciales	D1	D2
Compuestos de fórmula [I-1]	Compuestos de fórmula (I) (Reivindicaciones, Págs. 90 a 95)	Compuestos de fórmula (I) (Reivindicaciones, Pág. 22)

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 14 porque divulga inhibidores de la protein-quinasa P38 con actividad antianémica (Pág. 3, línea 31), cuya estructura anular es de 3-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-7-il)benzamidas (Págs. 1, 90 y 91, Resumen).

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 14 y las enseñanzas del documento D1 consiste en la presencia del sustituyente ácido-carbamilo-alkil-carboxílico sobre la posición 8 del anillo fusionado de 7-hidroxi[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina.

El efecto técnico que se origina al diseñar 7-hidroxi[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridinas sustituidas por ácido-carbamoil-alquil-carboxílico sobre la posición 8 consiste en obtener alternativas terapéuticas para inhibir la prolil hidroxilasa (PHD) humana y modular la producción de eritropoyetina (EPO) humana.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver la invención consiste en: cómo diseñar inhibidores de PHD humana alternativos a los conocidos.

Sin embargo, el documento D2 divulga compuestos de fórmula (I) que presentan actividad antagonista de HIF prolil-hidroxilasas para el tratamiento de anemia. (Resumen). Específicamente, el documento D2 menciona pirazolo[3,4-b]piridinas que presentan un sustituyente tipo ácido-carbamoil-alquil-carboxílico sobre la posición 5 del anillo fusionado según el ejemplo 6 (Pág. 18). En este documento se divulga que los compuestos presentan valores de EC50 en el rango comprendido entre 1 y 20µM (Pág. 21, líneas 20 a 25).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia contaba con la sugerencia o motivación razonable para diseñar compuestos alternativos que conserven el núcleo de 7-hidroxi[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridinas como lo divulga el documento D1, y de introducir grupos ácido-carbamoil-alquil-carboxílico como sustituyentes del anillo fusionado como lo divulga el documento D2 para inhibir la prolil-hidroxilasa humana (PHD), por lo cual, la reivindicación 14 se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones 15 a 26 no divulgan elementos característicos adicionales, se considera que dichas reivindicaciones tampoco cumplen con el requisito de nivel inventivo.

10. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2008107125	1 a 40	Nivel Inventivo
D2	WO2007136990	1 a 40	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 del día siguiente 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 2014-02-18

Elaboró: John Fredy Hernandez Montaño
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Roza
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez