

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 12-73061- -9	FECHA: 2014-08-29 17:13:22
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 13
ACT: 519 PRESENTACION	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
CARLOS REINALDO OLARTE GARCIA

Asunto: Radicación: 12-73061- -9
 Trámite: 11
 Evento: 378
 Actuación: 519
 Oficio: 11169
 Folios: 13

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/US2010/055519				
Fecha de Presentación Internacional	04/11/2010				

1. Documentos estudiados

Descripción:	Radicado N°12-073061-00000-0000	Mayo 4 de 2012
Reivindicaciones	Radicado N°12-073061-00000-0000	Mayo 4 de 2012
	Radicado N°12-073061-00008-0000	Julio 31 de 2013
Oposición	Radicado N°12-073061-00005-0000	Lafrancol S.A.S Enero 15 de 2013
Respuesta del solicitante	Radicado N°12-073061-00008-0000	Julio 31 de 2013
Prioridad:	US 61/259,093	Noviembre 6 de 2009

2. Análisis de la Prioridad

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

3. Modificaciones no aceptadas (Art 34 D 486 y Art 19, 22 y 34 PCT)

El pliego reivindicatorio bajo el radicado N°12-073061-00008-0000 no es aceptado, porque constituye ampliación de la materia no soportada en el capítulo descriptivo, porque la reivindicación 15 reclama una composición que contiene un

compuesto de la solicitud y uno o más agentes anticancerígenos seleccionados de la lista mencionada. Sin embargo, la descripción claramente menciona un método de tratamiento que consiste en la administración de los compuestos de la presente solicitud en combinación con los agentes anticancerígenos mencionados (Ver párr. [0116]), pero no ilustra composiciones farmacéuticas ni se evidencia la obtención de las mismas. La solicitud se limita a describir la obtención de composiciones que contienen únicamente los compuestos obtenidos de la estructura de la reivindicación 1 (Ver párr. [0231] – [0235]).

4. Objeto de la invención

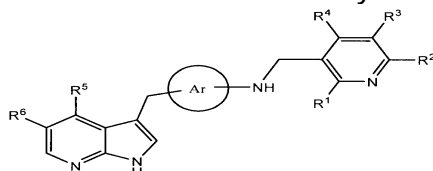
De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del Capítulo Primero del Título 10 de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por el solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es que cuando la solicitud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

Se realizará el estudio de las reivindicaciones 1 a 52 presentes en el Radicado N°12-073061-00000-0000. Sin embargo, se invita al solicitante para que realice el respectivo pago de las reivindicaciones adicionales 11 a 52.

Título de la solicitud: “Compuestos y métodos para la modulación de cinasas e indicaciones para ello”

El problema planteado en esta solicitud consiste en la obtención de compuestos alternativos inhibidores de Kinasa para el tratamiento de enfermedades inflamatorias y autoinmunes.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio plantea la obtención de compuestos de la Fórmula II', como inhibidores de las Kinasas FMS, KIT y FLT-3, para el tratamiento de enfermedades inflamatorias y autoinmunes.



El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A01N43/90; A61K31/519.

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

El objeto de las reivindicaciones 38 y 40 a 46 no es patentable, de acuerdo con el artículo citado.

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

El uso de las reivindicaciones 39 y 49 a 51 no es patentable, de acuerdo con el artículo 14.

7. De la Solicitud de la Patente

Título

El título de la presente solicitud se considera muy general y ambiguo, porque al mencionar “compuestos para modulación de cinasas”, se incluye una cantidad indefinida de posibles compuestos que poseen esta propiedad, pero que no hacen

parte del objeto de la presente solicitud. Al observar la descripción, los compuestos descritos como moduladores de kinasas son derivados de 3 – [2 – (piridin – 3 – il) metilamino – 6 – fluoropiridin – 5 – il] metil pirido [2,3-b] piridina. Se solicita modificar el título de la solicitud, de acuerdo con las observaciones anteriores y eliminando las expresiones relacionadas con el uso y con los métodos de tratamiento.

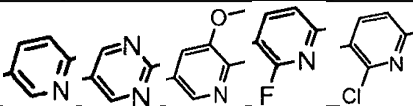
Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 no es concisa porque para los compuestos de la fórmula I’ se mencionan sustituyentes bajo términos muy general tales como “alquilo inferior, alquilo inferior sustituido con halógeno, alquenilo inferior, alquinilo inferior, cicloalquilo, heterocicloalquilo, dialquilamino, clcloalquilamino, entre otros más”, de tal manera que a partir de los mismos se puede obtener una cantidad muy amplia de posibles compuestos, los cuales no están debidamente soportados en la descripción.

Además, se mencionan sustituyentes secundarios no evidentes en la estructura de la Fórmula II’, tales como “OR¹⁰, CONHR¹¹, COOR¹¹, SO₂R¹², SO₂NHR¹¹, NHSO₂R¹², OR¹³, CONHR¹³, COOR¹⁴, SO₂R¹⁵, SO₂NHR¹⁴, NHCOR¹⁵, NHSO₂R¹⁵, OR²⁰, SO₂R²¹, SO₂NHR²², NHR²², entre otras más” a partir de las cuales se pueden obtener una cantidad amplia de compuestos posibles, pero no soportados dentro de la descripción.

Adicionalmente, al incluir los tautómeros, estereoisómeros, profármacos y demás modificaciones estructurales, el objeto de la solicitud se amplía considerablemente y no se encuentran soportados en la descripción.

Teniendo en cuenta las consideraciones anteriores, a partir de la estructura de Fórmula II’ se pueden obtener muchos compuestos posibles, incrementando la complejidad de la solicitud y por lo tanto no es posible establecer un alcance certero de lo que se desea proteger dentro de la invención. Se solicita realizar una restricción detallada y específica de los sustituyentes, de tal manera que a partir de los mismos se obtengan los compuestos sintetizados, probados y que constituyen la solución al problema técnico objetivo planteado en la presente invención. Es cierto que el inventor tiene el derecho de proteger su invención en la extensión que lo considere conveniente, sin embargo, de acuerdo a lo descrito en el artículo 30 de la Decisión 486, las reivindicaciones que definen una invención deben ser claras, concisas y deben estar debidamente soportadas en el capítulo descriptivo. Se sugiere al solicitante realizar dicha restricción de acuerdo a lo soportado dentro de la descripción y se muestra en la siguiente tabla:

Sustituyente	Soportados en la descripción
Ar	
R ⁵	H, C≡CH
R ⁶	H, CH ₃ , Br, Cl, F, OCH ₃ , CF ₃ , ciclopropil, CN, pirazolil, NHCOCH ₃ , NHSO ₂ CH ₃ , SO ₂ CH ₃ ,
R ¹	H, OCH ₃ , CH ₃ , F, CF ₃ , NHCH ₃ , OCH(CH ₃) ₂ , morfolin, ciclopentiloxi, ciclohexiloxi,
R ²	H, F, Cl, OCH ₃ , CF ₃ ,
R ³	H, F, Cl, CF ₃ , OCH ₃ ,
R ⁴	H, F, Cl, CF ₃ , OCH ₃ , CH ₃ ,

Para las reivindicaciones 2 a 7, 9 a 12 y 18 a 33 se solicita realizar las mismas restricciones sugeridas en los párrafos anteriores, dado que persiste la falta de concisión de los sustituyentes mencionados.

Para la reivindicación 48 se solicita mencionar los reactivos empleados y las condiciones de reacción bajo las cuales se obtienen los compuestos de la reivindicación 1. Adicionalmente, se solicita eliminar las definiciones de Ar, R⁶, R¹⁶,

R¹³, R¹⁴, R¹⁵, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, R¹⁹, R²⁰, R²¹, R²² y R²³, porque se mencionaron anteriormente en el contenido de la reivindicación 1.

Se solicita eliminar la reivindicación 52, porque se repite la materia ya mencionada dentro de la reivindicación 37.

Descripción (Art 28 D 486)

Las características referentes a las composiciones que se mencionan en la reivindicación 47 no se mencionan en la descripción, pueden ser incorporadas a la descripción para que estén sustentadas. Esta modificación no supone ampliación puesto que las reivindicaciones iniciales, que mencionan dichas características, fueron presentadas con la descripción.

8. Análisis de las Oposiciones

Argumentos de Lafrancol S.A.S.

La sociedad Lafrancol S.A.S. menciona que la presente solicitud pretende obtener beneficio patentario para compuestos moduladores de Kinasa y sus combinaciones con otros fármacos, para el tratamiento de enfermedades inflamatorias y autoinmunes.

De acuerdo a lo anterior, la sociedad opositora afirma que las composiciones y combinaciones que comprenden compuestos de la presente solicitud y otros agentes que pueden ser alquilantes, antibióticos, un agente de inmunoterapia, un taxano, entre otros compuestos para el tratamiento de la artritis reumatoide y otras enfermedades, son prácticas y eventos totalmente conocidos en el campo químico farmacéutico y por lo tanto, no son nuevos ni contienen altura inventiva alguna, dado que compuestos como carboplatino, gemcitabina, pemetrexed, bevacizumab, imatinib, entre otros son plenamente conocidos e identificados y que contienen beneficio patentario. Además, la sociedad opositora menciona que las combinaciones para obtener un efecto sinérgico no se considera una invención, sino un descubrimiento encontrado durante estudios clínicos, por lo que se considera como un método de tratamiento.

Como evidencia, la sociedad opositora adjunta las monografías del Index Merck 2006 correspondientes al carboplatino (Pág. 1822), gemcitabina (Pág. 4386), pemetrexed (Pág. 7079), bevacizumab (Pág. 1192) e imatinib (Pág. 4905).

Respuesta del solicitante

La sociedad Plexxikon Inc., como respuesta a los argumentos de la sociedad opositora Lafrancol S.A.S., como primera medida modifica el capítulo reivindicatorio que restringe el objeto de la presente solicitud.

La sociedad solicitante afirma que dentro el objeto de la solicitud consiste en un compuesto de la Fórmula II', eventualmente en combinación con alquilantes, antibióticos, un agente de inmunoterapia, un taxano, entre otros. Con respecto a las monografías del Index Merck, es cierto que las moléculas descritas son ampliamente conocidas y susceptibles de combinación, no se anticipa la materia reclamada en la solicitud ni la hace obvia para una persona medianamente versada en la materia.

Las patentes citadas en la oposición no tienen relación alguna con los compuestos e la solicitud, sino que se refieren a los compuestos carboplatino, gemcitabina, pemetrexed, bevacizumab e Imatinib, y no divulgan las características técnicas esenciales de los compuestos del Fórmula II'. Por lo tanto, la presente solicitud se

puede considerar como nueva e inventiva la luz de los documentos mencionados en la presente oposición.

Respuesta del Examinador Técnico

Después del análisis de los argumentos expuestos por la sociedad opositora Lafrancol S.A.S. y de los argumentos de la sociedad solicitante Plexxikon Inc., es necesario establecer que los argumentos ni los documentos citados por la sociedad opositora anteceden el objeto de la presente solicitud. Ciertamente los compuestos relacionados en el Index Merck son ampliamente conocidos en el estado de la técnica, pero dentro de este soporte documental no se mencionan los compuestos de Fórmula II¹ ni se menciona la posibilidad de obtener composiciones y combinaciones farmacéuticas que contengan los compuestos de la fórmula II¹ y otros agentes anticancerígenos. De acuerdo a lo anterior, esta Oficina concluye que la oposición presentada por la sociedad Lafrancol S.A.S., se declara infundada.

Por lo tanto, los argumentos mencionados en la oposición no desvirtúan la Novedad ni el Nivel Inventivo de la presente solicitud, por lo cual no serán tenidos en cuenta dentro del Examen de Patentabilidad.

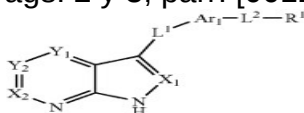
9. Determinación del Estado de la Técnica

El Estado de la Técnica se determinó con base en la fecha de solicitud de prioridad: Noviembre 6 de 2009.

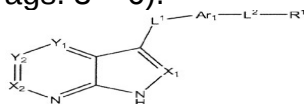
Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos que anticipa el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	US2009/0076046	"Compound modulating C – FMS and/or C - KIT activity and uses thereof"	19/Marzo/2009
D2	WO2008/064265	"Compound modulating C – FMS and/or C - KIT activity and uses thereof"	29/Mayo2008
D3	WO2008/063888	"Compound modulating C – FMS and/or C - KIT activity and uses thereof"	29/Mayo2008

El documento D1¹ divulga compuestos derivados de pirrolo [2,3-b] piridina de la Fórmula I, como inhibidores de las kinasas C-KIT y C-FMS, para el tratamiento de enfermedades autoinmunes (Págs. 2 y 3, párr. [0012] – [0034]).



El documento D2² divulga compuestos derivados de pirrolo [2,3-b] piridina de la Fórmula I, como inhibidores de las kinasas C-KIT y C-FMS, para el tratamiento de enfermedades autoinmunes (Págs. 3 – 6).



El documento D3³ divulga compuestos derivados de pirrolo [2,3-b] piridina de la Fórmula II, como inhibidores de las kinasas C-KIT y C-FMS, para el tratamiento de

1 [http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2009076046A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20090319&DB=worldwide.espacenet.com&locale=es_ES)

CC=US&NR=2009076046A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20090319&DB=worldwide.espacenet.com&locale=es_ES

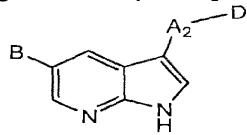
2 [http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2008064265A2&KC=A2&FT=D&ND=3&date=20080529&DB=worldwide.espacenet.com&locale=es_ES)

CC=WO&NR=2008064265A2&KC=A2&FT=D&ND=3&date=20080529&DB=worldwide.espacenet.com&locale=es_ES

3 [http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2008063888A2&KC=A2&FT=D&ND=3&date=20080529&DB=worldwide.espacenet.com&locale=es_LP)

CC=WO&NR=2008063888A2&KC=A2&FT=D&ND=3&date=20080529&DB=worldwide.espacenet.com&locale=es_LP

enfermedades autoinmunes (Págs. 3 – 7, párr. [0011]).



10. Examen de Patentabilidad.

Novedad (Art 16 D 486)

La reivindicación 1 divulga “Un compuesto que tiene la Fórmula I’, en donde...”
(Pág. 289 y 290 del Radicado N°12–073061–00000–0000)

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Solicitud	D1
Compuesto de la fórmula I’ R³, R⁴ y R⁵ son H	Compuestos P-0181, P-0182, P-0173, P-0282, P-0283, P-0284, P-0285, P-0286, P-0287, P-0331, P-0332, P-0232, P-0233, P-0234, P-00164, P-0173 (Pág. 98, 99, 102, 103, 107, 110 y 146)
Ar es R⁷, R⁸ y R⁹ son H o halógeno	
R¹ es H, halógeno, alcoxi inferior	H, Cl, OCH ₃ en la posición 2 del anillo piridin – 3 – ilmetilamino
R² es H, halógeno, alcoxi inferior, alquilo	H, CF ₃ , OCH ₃ en la posición 6 del anillo piridin – 3 – ilmetilamino

inferior sustituido con halógeno	
R ⁶ es H, halógeno, alquilo inferior, CN, OR ¹³ (R ¹³ es alquilo inferior)	H, CH ₃ , OCH ₃ , Cl , CN en posición 5 de la anillo de pirrolo [2,3-b] piridina

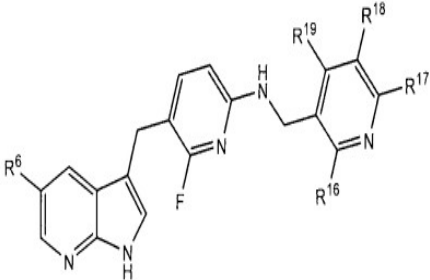
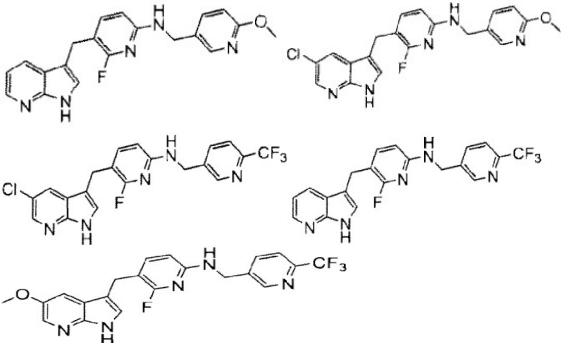
Las características técnicas esenciales de los compuestos de la Fórmula I´ de acuerdo con la reivindicación 1, han sido divulgados previamente en D1 (D1: Pág. 98, comp. P-0181, P-0182; pag. 99, comp. P-0173; pág. 102, comp. P-0282, P-0283, P-0284, P-0285; pág. 103, comp. P-0286, P-0287; pág. 107, comp. P-0331, P-0332; pág. 110, comp. P-0232, P-0233, P-0234; pág. 146, comp. P-0164, P-0173), donde se mencionan compuestos específicos derivados de 3-[2-(piridin-3-il) metilamino piridin-5-il] metil pirido [2,3-b] piridina, como moduladores de kinasa para el tratamiento de enfermedades inflamatorias y autoinmunes, con las características técnicas esenciales descritas en la tabla anterior.

En consecuencia, la reivindicación 1, de acuerdo con lo divulgado en D1, carece de Novedad.

Las reivindicaciones 2, 3, 6 a 18, 34 a 37 y 52 dependientes de la reivindicación 1, no divulgan características adicionales que otorguen novedad a los compuestos de la presente solicitud. Por lo tanto, estas reivindicaciones también carecen de Novedad.

La reivindicación 19 divulga “*Un compuesto que tiene la Fórmula II´, en donde...*” (Pág. 291 y 292 del Radicado N°12-073061-00000-0000)

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Solicitud	D2
Compuesto de la fórmula II´ 	Compuestos (Pág. 296, párr. [0731]; pág. 297, párr. [0732]; pág. 273, párr. [0736]) 
R ⁶ es H, halógeno, OR ¹³ (R ¹³ es alquilo inferior)	H, Cl, OCH ₃ en posición 5 del anillo de pirrolo [2.3-b] piridina
R ¹⁶ , R ¹⁸ y R ¹⁹ son H	H en posiciones 2, 4 y 5 del grupo piridin – 3 – ilmetilamino
R ¹⁷ es H, alcoxi inferior, alquilo inferior halosustituido	H, CF ₃ , OCH ₃ en posición 6 del grupo piridin – 3 - ilmetilamino

Las características técnicas esenciales de los compuestos de la Fórmula II´ de acuerdo con la reivindicación 19, han sido divulgados previamente en el documento D2 (D2: Pág. 296, párr. [0731]; pág. 297, párr. [0732]; pág. 273, párr. [0736]), donde se mencionan compuestos específicos derivados de 3-[2-(piridin-3-il) metilamino- 6-fluoropiridin-5-il] metil pirido [2,3-b] piridina, como moduladores de kinasa para el tratamiento de enfermedades inflamatorias y autoinmunes, con las características técnicas esenciales descritas en la tabla anterior.

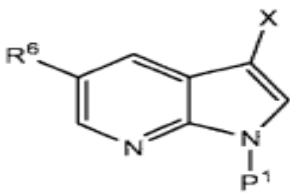
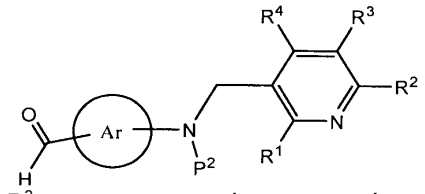
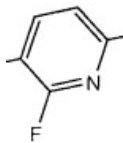
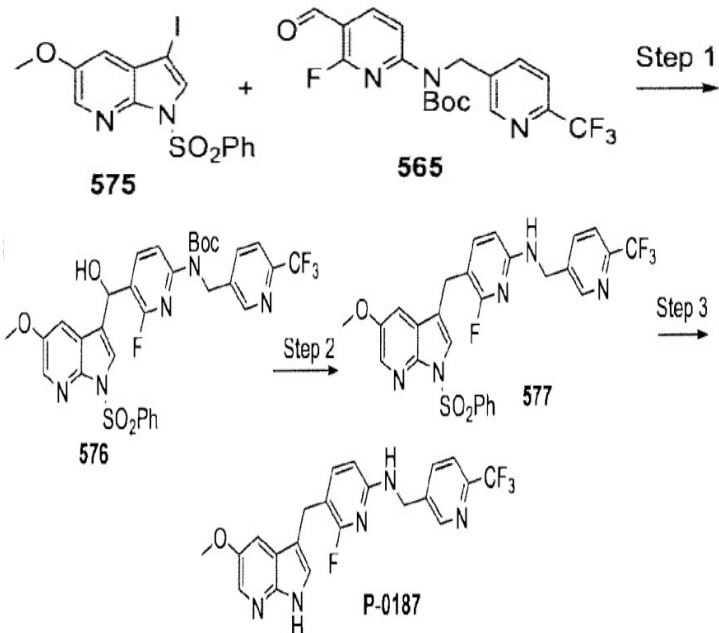
En consecuencia, la reivindicación 19, de acuerdo con lo divulgado en D2, carece

de Novedad.

Las reivindicaciones 20, 21, 25 a 27, 34 a 37 y 52 dependientes de la reivindicación 19, no divulgan características adicionales que otorguen novedad a los compuestos de la presente solicitud. Por lo tanto, estas reivindicaciones también carecen de Novedad.

La reivindicación 48 divulga “Un método para preparar un compuesto de la Fórmula II’, de acuerdo con la reivindicación 1, que comprende: Hacer que un compuesto de Fórmula IV entre en contacto con un compuesto de Fórmula V, donde P¹ y P² son grupos protectores de grupo amino, X es H o halógeno...” (Pág. 288 y 289 del Radicado N°12-073061-00000-0000)

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Solicitud	D2
Síntesis compuestos de Fórmula II’	Síntesis del compuesto P-0187 (Pág. 297, párr. [0732], esquema 179)
Poner en contacto el compuesto de Fórmula IV  (X es halógeno y P¹ es un protector de grupo amino) con el compuesto de fórmula V  P² es un protector de grupo amino y Ar es 	Reacción entre los compuesto 575 y 576 para obtener el compuesto P-0187 (previa desprotección de los intermediarios 576 y 577) 

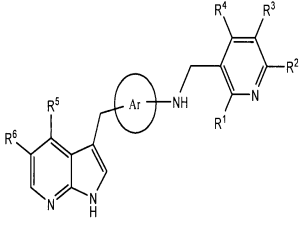
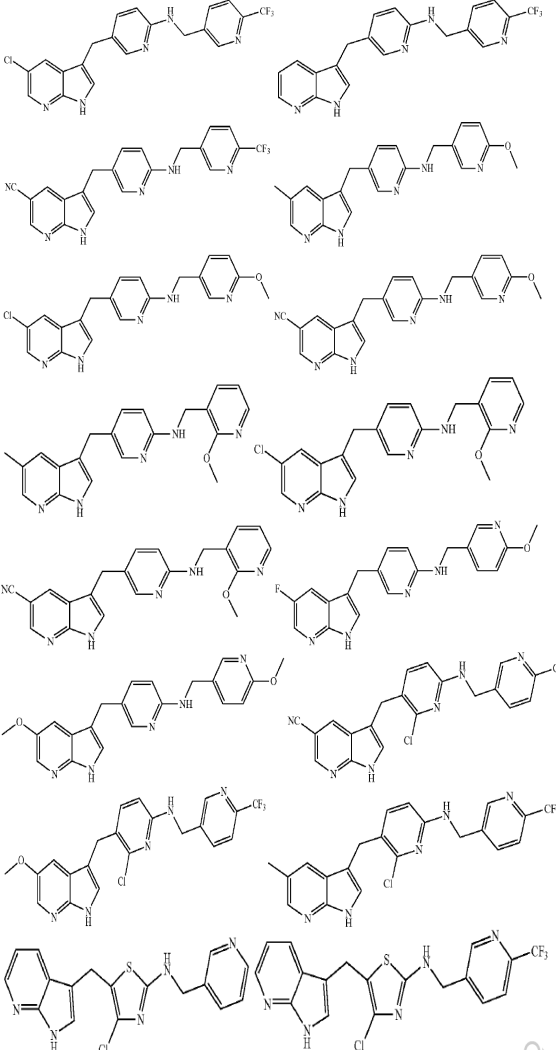
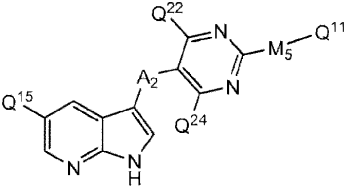
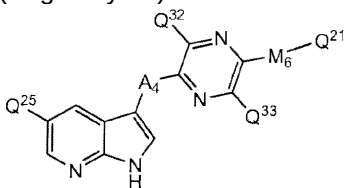
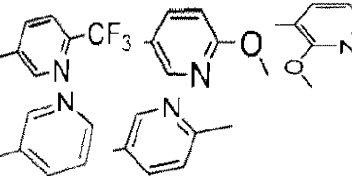
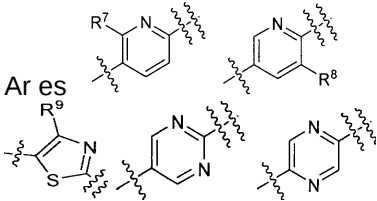
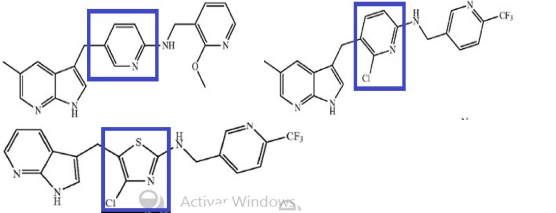
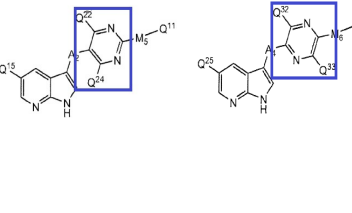
Las características técnicas esenciales del proceso de síntesis de los compuestos de la Fórmula I’ de acuerdo con la reivindicación 48, han sido divulgadas previamente en D2 (D2: Pág. 297, párr. [0732], esquema 179), donde se menciona la obtención del compuesto P-0187 mediante la reacción entre los compuestos 575 y 565, con la respectiva desprotección de los grupos amino de los intermediarios 576 y 577, de acuerdo con los pasos 1, 2 y 3 explicados en las páginas 297 y 298, párr. [0372] – [0375], con las características técnicas esenciales descritas en la tabla anterior.

En consecuencia, la reivindicación 48, de acuerdo con lo divulgado en D2, carece de Novedad.

Nivel Inventivo (Art 18 D 486)

La reivindicación 1 divulga “Un compuesto que tiene la Fórmula I’, en donde...”
(Pág. 289 y 290 del Radicado N°12-073061-00000-0000)

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Solicitud	D1	D3
Compuesto de la fórmula I’  R³, R⁴ y R⁵ son H	Compuestos P-0181, P-0182, P-0173, P-0282, P-0283, P-0284, P-0285, P-0286, P-0287, P-0331, P-0332, P-0232, P-0233, P-0234, P-00164, P-0173 (Pág. 98, 99, 102, 103, 107, 110 y 146) 	Compuesto de la fórmula IIb (Pág. 36 y 37)  Donde A₂ es CR¹⁹R²⁰ (C¹⁹ y C²⁰ son H), M₅ es NR²⁶CR¹⁹R²⁰ (C¹⁹, C²⁰ y C²⁶ son H), Q¹¹ es heteroarilo sustituido Compuesto de la fórmula IIc (Pág. 44 y 45)  Donde A₄ es CR¹⁹R²⁰ (C¹⁹ y C²⁰ son H), M₆ es NR²⁶CR¹⁹R²⁰ (C¹⁹, C²⁰ y C²⁶ son H), Q²¹ es heteroarilo sustituido Q¹¹ y Q²¹ pueden ser  (Pág. 201, comp. P-0181; pág. 202, comp. P-0283, P-0285; pág. 262, comp. P-0164; pág. 281, comp. P-108)
Ar es  R⁷, R⁸ y R⁹ son H o halógeno		
R ¹ es H, halógeno, alcoxi inferior	H, Cl, OCH ₃ en la posición 2 del anillo piridin – 3 – ilmetilamino	Q ¹¹ y Q ²¹ pueden ser sustituidos por CH ₃ , OCH ₃ , CF ₃
R ² es H, halógeno, alcoxi inferior, alquilo inferior sustituido con halógeno	H, CF ₃ , OCH ₃ en la posición 6 del anillo piridin – 3 – ilmetilamino	
R ⁶ es H, halógeno, alquilo inferior, CN, OR ¹³ (R ¹³ es alquilo inferior)	H, CH ₃ , OCH ₃ , Cl , CN en posición 5 de la anillo de pirrolo [2,3-b] piridina	Q ¹⁵ y Q ²⁵ son H, halógeno, alquilo inferior, CN, OR ²³ (OR ²³ es alquilo inferior)

El documento D1 se considera el estado de la técnica más cercano a los compuestos de la presente solicitud de acuerdo con la reivindicación 1, porque se mencionan compuestos derivados de 3-[2-(piridin-3-il) metilamino piridin-5-il] metil pirido [2,3-b] piridina y derivados de 3-[2-(piridin-3-il) metilamino-6-

cloropiridin-5-il] metil pirido [2,3-b] piridina, como moduladores de kinasas FMS, KIT, para el tratamiento de enfermedades inflamatorias y autoinmunes (D1: Pág. 98, comp. P-0181, P-0182; pag. 99, comp. P-0173; pág. 102, comp. P-0282, P-0283, P-0284, P-0285; pág. 103, comp. P-0286, P-0287; pág. 107, comp. P-0331, P-0332; pág. 110, comp. P-0232, P-0233, P-0234; pág. 146, comp. P-0164, P-0173)

La diferencia entre los compuestos descritos en la solicitud en estudio con respecto a los compuestos divulgados en el documento D1, radica en que los compuestos de la presente solicitud contiene un grupo sustituyente Ar que puede ser piridin, tiazolil, piridinil o piridazil, mientras que los compuestos descritos en el documento D1 contienen apenas grupos heterocíclicos piridin o tiazolil (recuadro azul) como sustituyentes del 3 – ilmetil pirido [2,3-b] piridina.

Esta diferencia no parece conceder un efecto técnico inesperado o superior a los compuestos de la Fórmula I' de la presente solicitud, con respecto a los compuestos descritos en el documento D1.

El problema técnico objetivo que se pretende resolver es el siguiente: Cómo modificar los compuestos divulgados en el documento D1 para obtener compuestos alternativos derivados de pirido [2,3-b] piridina, para el tratamiento de enfermedades inflamatorias y autoinmunes.

El documento D3 divulga compuestos de las fórmulas IIb y IIc, derivados de pirido [2,3-b] piridina que contiene un grupo aromático que puede ser un grupo pirimidin o un grupo piridazin (Pág. 36, 37, 44, 45; pág. 201, comp. P-0181; pág 202, comp. P-0283, P-0285; pág. 262, comp. P-0164; pág. 281, comp. P-108).

Por lo tanto, una persona normalmente versada en la materia y conocedora de los conceptos mencionados en los documentos D1 y D3, sin ningún esfuerzo, modificaría los compuestos descritos en el documento D1, modificando el anillo, de tal manera que el grupo 3 – ilmetil pirido [2,3-b] piridina tenga un sustituyente piridinil o piridazil, para obtener los compuestos propuestos en esta solicitud, de manera obvia o evidente.

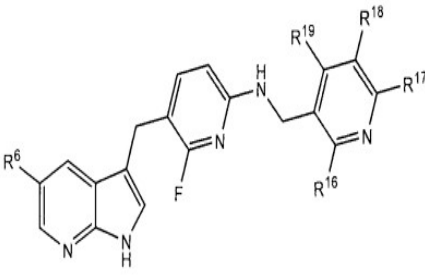
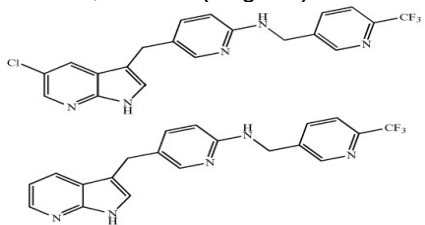
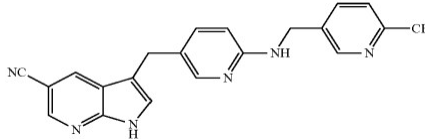
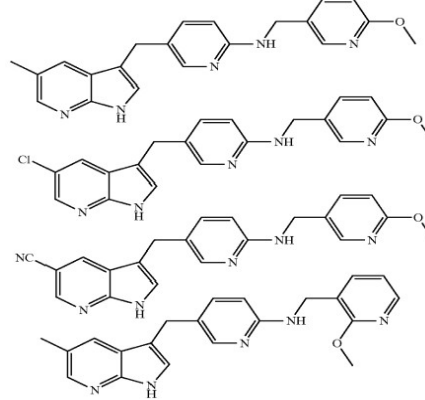
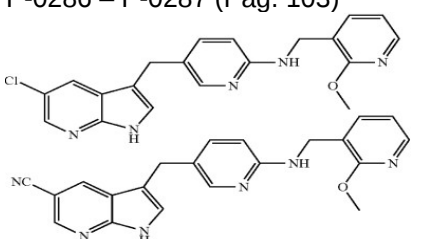
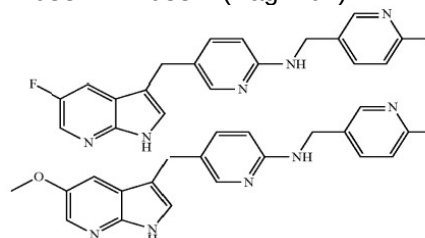
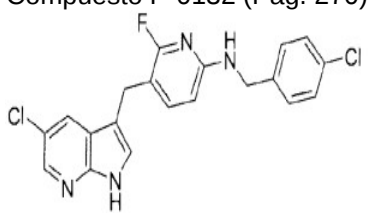
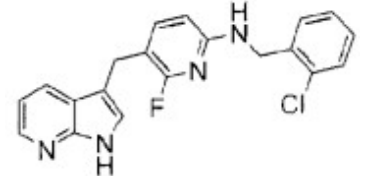
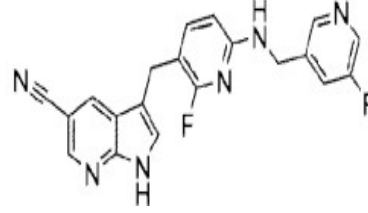
En consecuencia, la reivindicación 1, de acuerdo con los documentos D1 y D3, carece de Nivel Inventivo.

Las reivindicaciones 2 a 37, 48 y 52 dependientes de la reivindicación 1, no divulgan características técnicas adicionales que confieran nivel inventivo a los compuestos de la reivindicación 1. Por lo tanto, estas reivindicaciones, también carecen de Nivel Inventivo.

La reivindicación 19 divulga “Un compuesto que tiene la Fórmula II', en donde...” (Pág. 291 y 292 del Radicado N°12-073061-00000-0000)

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Solicitud	D1	D2
-----------	----	----

Compuesto de la fórmula II' 	Compuestos P-0181, P-0182 (Pág. 98)  P-0273 (Pág. 99)  P-0282 – P-0285 (Pág. 102)  P-0286 – P-0287 (Pág. 103)  P-0331 – P-0332 (Pág. 107) 	Compuesto P-0132 (Pág. 270)  Compuesto P-0335 (Pág. 311)  Compuesto P-0415 (Pág. 352) 
F en posición 2 del anillo de (6 – aminometil) piridin – 3 – ilmetil	No se menciona	F en posición 2 del anillo de (6 – aminometil) piridin – 3 – ilmetil
R ⁶ es H, halógeno, alquilo inferior, CN, OR ¹³ (R ¹³ es alquilo inferior)	H, CH ₃ , OCH ₃ , F, Cl, CN en posición 5 del anillo de pirrolo [2.3-b] piridina	H, Cl, CN en posición 5 del anillo de pirrolo [2.3-b] piridina
R ¹⁶ es H, alcoxi inferior	H, OCH ₃ en posición 2 del grupo piridin – 3 – ilmetilamino	No se menciona
R ¹⁷ es H, alcoxi inferior	H, OCH ₃ en posición 6 del grupo piridin – 3 – ilmetilamino	No se menciona
R ¹⁸ y R ¹⁹ son H	H en posiciones 4 y 5 del grupo piridin – 3 – ilmetilamino	No se menciona

El documento D1 se considera el estado de la técnica más cercano a los compuestos de la solicitud de acuerdo con la reivindicación 19, porque se mencionan compuestos derivados de 3-[2-(piridin-3-il) metilamino piridin-5-il] metil pirido [2,3-b] piridina, como moduladores de kinasas FMS, KIT, para el tratamiento de enfermedades inflamatorias y autoinmunes (D1: Pág. 98, comp. P-0181 y P-0182; pág. 99, comp. P-0273; pág. 102, comp. P-0282 – P-0285; pág. 103, comp. P-0286 y P-0287; pág. 107, comp. P-0331 – P-0332).

La diferencia entre los compuestos descritos en la solicitud en estudio con respecto a los compuestos divulgados en el documento D1, radica en que los compuestos de la presente solicitud contienen un F en la posición 2 del anillo de 6–metilamino piridin–3–ilmetil.

Esta diferencia no parece conceder un efecto técnico inesperado o superior a los compuestos de la Fórmula II' de la presente solicitud, con respecto a los compuestos descritos en el documento D1, por cuanto es conocido ampliamente el isosterismo entre un F y un H. Adicionalmente, el grupo farmacóforo es el mismo, lo cual indica una actividad similar.

El problema técnico objetivo que se pretende resolver es el siguiente: ¿Cómo modificar los compuestos divulgados en el documento D1 para obtener compuestos alternativos derivados de pirido [2,3-b] piridina, para el tratamiento de enfermedades inflamatorias y autoinmunes?

El documento D2 divulga compuestos derivados de 3–metilamino piridin–5–il] metil pirido [2,3-b] piridina, donde en la posición 2 del anillo de (6– aminometil) piridin–3–ilmetil se incluye un átomo de F como sustituyente (Pág. 270, comp. P-0132; pág. 311, comp. P-0335; pág. 352, comp. P-0415).

Por lo tanto, una persona normalmente versada en la materia y conocedora de los conceptos mencionados en los documentos D1 y D2, sin ningún esfuerzo, modificaría los compuestos descritos en el documento D1, de tal manera que incluiría un átomo de F en la posición 2 del anillo de (6–aminometil) piridin–3–ilmetil, como lo sugiere el documento D2, para obtener los compuestos propuestos en esta solicitud, de manera obvia o evidente.

En consecuencia, la reivindicación 19, de acuerdo con los documentos D1 y D2, carece de Nivel Inventivo.

Las reivindicaciones 20 a 27, 34 a 37 y 52, dependientes de la reivindicación 1, no divulgan características técnicas adicionales que confieran nivel inventivo a los compuestos de la reivindicación 1. Aunque la reivindicación 22 reclama un compuesto de Fórmula II (donde R⁶ es específicamente CH₃) y la reivindicación 25 reclama un compuesto de Fórmula IIa (donde R⁶ es específicamente CN), en el documento D1 se divulgan compuestos donde los grupos CH₃ y CN en la posición 5 del anillo de pirido [2,3-b] piridina son sustituyentes esenciales. Por lo tanto, estas reivindicaciones, también carecen de Nivel Inventivo.

11. Conclusión

Los requisitos de Patentabilidad de esta solicitud se ven afectados de la siguiente manera:

Item	Documento	Reivindicaciones	Requisitos que afecta
D1	US2009/0076046	1 a 3, 6 a 18, 34 a 37 y 52	Novedad
		1 a 37, 48 y 52	Nivel Inventivo
D2	WO2008/064265	19 a 21, 25 a 27, 34 a 37, 48 y 52	Novedad
		19 a 27, 34 a 37 y 52	Nivel Inventivo
D3	WO2008/063888	1 a 37, 48 y 52	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 2014-09-02

Elaboró: Dayron Alexander Ramirez Reyes
Revisó: Consuelo Leguizamon Leguizamon