

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
CARLOS R. OLARTE
office@olartemoure.com

ASUNTO	Radicación	09 – 70739A
	Trámite	011
	Evento	378
	Actuación	519
	Oficio	
	Folios	5 17 4 2 4

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad
Vía Nacional		
Vía PCT (Fase Nacional)	☒	Capítulo I ☒ Capítulo II

No. Solicitud Internacional: PCT/US2007085304
Fecha de Presentación Internacional: Noviembre 20 de 2007

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 6 a 104	30 de Diciembre de 2011
Reivindicaciones	Folios 105 a 108	30 de Diciembre de 2011
Prioridad:	US 60/869.299	08 de Diciembre de 2006
	US 60/966.449	28 de Agosto de 2007

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. Presentación de Solicitud Fraccionaria (Art 36 D 486)

Se acepta para examen la solicitud fraccionaria presentada e identificada como 09 – 70739ª porque no implica ampliación de la materia contenida en la solicitud inicial.

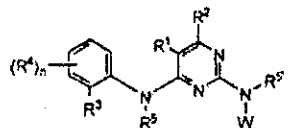
4. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "Compuestos y composiciones como Inhibidores de la Proteína Quinasa"

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de obtener moléculas que sean capaces de inhibir la sobreexpresión de diversas isoformas de la Tirocin Kinasa relacionadas con procesos oncogénicos múltiples y con trastornos del sistema inmune y a partir de estas obtener preparaciones farmacéuticas que sean indicadas para el

tratamiento de tumores hematológicos y no hematológicos, así como para el tratamiento de enfermedades autoinmunes.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona un conjunto de moléculas con sus respectivas composiciones farmacéuticas, derivados de la 2, 4 – diaminopirimidina, las cuales integran una preparación farmacéutica ya sean como únicos principios activos o en combinación con otros agentes antineoplásicos ampliamente conocido o en combinación con otros fármacos inmunomoduladores ampliamente conocidos.



El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D213/74; C07D239/48; C07D239/95; C07D401/12

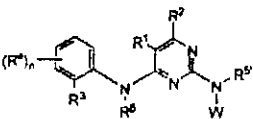
5. De la Solicitud de Patente

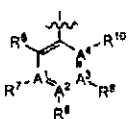
Titulo de la Invención

El titulo se considera muy general, debido a que bajo ese dominio se pueden abarcar muchos compuestos. Se sugiere que el titulo de esta solicitud sea mas especifico de acuerdo a lo divulgado como objeto de la invención

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 no es clara porque determina el compuesto de la Formula 1



Donde W es  , y de acuerdo a esta reivindicación A¹, A², A³ y A⁴ son carbonos. Entonces W equivale a benceno, con R⁵, R⁶, R⁷ y R¹⁰ siendo H. Se sugiere modificar esta reivindicación y, se sugiere restringir los sustituyentes a lo divulgado dentro del capítulo descriptivo, los cuales aplican de acuerdo a la siguiente tabla:

Sustituyente	Soportado en la descripción
R ¹ y R ²	Unidos forman anillo carbocíclico (benceno) o heterociclo (pirrol, imidazol o pirazol), todos opcionalmente sustituidos
R ³	Metilsulfonil o isopropilsulfonil
R ⁴	H
R ⁶	Isopropoxi
R ⁸	(CR ₂) _q Y donde R ₂ es H y q es 0
R ⁹	H y CH ₃
Y	Piperidin-2-il, piperidin-3-il y piperidin-4-il (opcionalmente N – sustituidas)

Dentro de esta misma reivindicación se enuncia que R⁶ es halo o alquilo, sin embargo, dentro de los compuestos divulgados en el capítulo descriptivo de esta solicitud, R⁶ corresponde a isopropoxi, por lo que se sugiere modificar dentro de la reivindicación 1 el sustituyente de R⁶

Se solicita eliminar los enunciados correspondientes a X y R¹³ porque no aplican dentro de esta reivindicación.

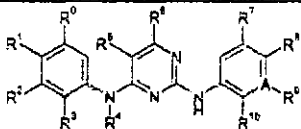
Las reivindicación 2 no es concisa porque al enunciar los posibles sustituyentes R¹², se genera una cantidad apreciable de compuestos. Se sugiere restringir las posibles sustituciones de R¹² a lo divulgado dentro del capítulo descriptivo.

6. Determinación del Estado de la Técnica

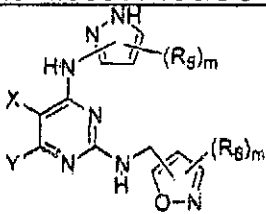
El Estado de la Técnica se determinó con base en la fecha de solicitud de prioridad: Diciembre 08 de 2006 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	WO2006021454	Pyrimidine compounds	26 de Agosto de 2005
D2	WO2006074057	Kinase modulators and method of use	28 de Diciembre de 2005

D1: Divulga obtención de novedosos compuestos derivados de 2,4 - pirimidindiamina y de sus respectivas preparaciones farmacéuticas para el tratamiento de neoplasias y alteraciones del sistema inmunitario.
http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=es_LP&FT=D&date=20060302&CC=WO&NR=2006021454A2&KC=A2



D2: Divulga la obtención de nuevas compuestos útiles para modular la actividad de Tirosin Kinasas y su inclusión dentro de preparaciones farmacéuticas .
http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=es_LP&FT=D&date=20060713&CC=WO&NR=2006074057A2&KC=A2



7. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel Inventivo (Art 18 D486)

La reivindicación 1 divulga un compuesto que tiene la Formula 1 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, donde... (Folio 105)

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

Solicitud	D1	D2
Compuesto de la Formula 1 Donde W es A¹, A², A³ y A⁴ son carbonos R⁵, R⁷ y R¹⁰ son H R¹ y R² forman un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros con 1 a 3 átomos de Nitrógeno (preferiblemente pirrol, pirazol o imidazol)	Compuesto de la Formula I A es carbono R⁵ es Cl o Br y R⁶ es H	Compuesto de la Formula V X e Y forman un anillo heterociclo de 4 a 7 miembros con uno o dos heteroátomos de N, O o S

Fenilo como sustituyente de los grupos amino unidos a la pirimidina	Fenilo como sustituyente de los grupos amino unidos a la pirimidina	Anillos heterociclo como sustituyente de los grupos amino unidos a la pirimidina (oxazol y pirazol)
R^4 y R^5 es H	R^2 y R^4 es H	No se menciona
R^3 es metilsulfonil, o isopropilsulfonil	R^3 es aminosulfonil o alquilsulfonil C_{1-7}	$(R^5)_m$ es aminosulfonil o heterociclosulfonil (m es 1)
R^8 es $(CR_2)_q$ Y donde R_2 es H, q es 0 e Y es N-metilpiperidina, piperidin-2-il, piperidin-4-il morfolina (opcionalmente sustituidos)	R^8 es amida o heterociclo (pirrol, piridina, piperidina, morfolina, piperazina) opcionalmente sustituido y unido al fenilo directamente o como alcóxido	$(R^6)_m$ es alcóxido, fenilo o heterociclo (m es 1 o 2)
R^6 es isopropoxi	R^{10} es metoxi	No se menciona
R^9 es H o CH_3	R^9 es H	No se menciona

D1 y D2 se consideran como Estados de la Técnica más cercanos (D1: Folios 106 y 107. D2: Folios 134 a 136). Donde tanto D1 como D2 divulgan compuestos derivados de diaminopirimidina como inhibidores o moduladores de Tirosin Kinasa.

La diferencia entre la invención y D1 es que en la invención los sustituyentes R^1 y R^2 unidos al anillo de pirimidina se unen formando un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros con 1 a 3 átomos de Nitrógeno (preferiblemente pirrol, pirazol o imidazol), mientras que en D1 los sustituyentes R^5 y R^6 unidos al anillo de pirimidina son respectivamente un halógeno (Cl o Br) y H

La diferencia entre la invención y D2 es que en la invención los sustituyentes de los grupos amino unidos al anillo de pirimidina son grupos fenilo, mientras que en D2 los sustituyentes de los grupos amino unidos al anillo de pirimidina son anillos heterocíclicos de oxazol y pirazol respectivamente.

Por lo tanto, una persona versada en la materia conocedora de los Estados de la Técnica D1 y D2, sin ningún esfuerzo lograría combinar los conceptos divulgados en estos documentos, de manera tal que al anillo de pirimidina en D2 donde X e Y forman un heterociclo, se puede modificar los anillos sustituyentes de los grupos amino en las posiciones 2 y 4, de manera que al cambiar los anillos de imidazol y de oxazol sugeridos en D2 por los anillos de benceno sustituidos que sugieren D1 como sustituyentes de los grupos amino en las mismas posiciones 2 y 4 del anillo de pirimidina, e incluir en el sustituyente R^{10} de D1 el grupo isopropoxi en vez del metoxi, llegando de esta manera a los compuestos de esta invención de manera evidente.

Se sabe que tanto el benceno, como el oxazol y el pirazol son anillos aromáticos que presentan como característica esencial el fenómeno de resonancia, dando lugar a variación de la distribución electrónica dentro de sus estructuras y siendo este el medio de la interacción con el receptor. Por lo tanto, el cambio de estos anillos heterocíclicos por anillos carbocíclico aromáticos no generaría alguna ventaja o algún efecto técnico inesperado.

Además, se observa en D2 (Folios 116 a 121) las determinaciones cuantitativas de los valores de IC_{50} para inhibir la Tirosin Kinasa para cada uno de los compuestos obtenidos, mientras que en el capítulo descriptivo de esta solicitud no se muestran datos de actividad para inhibir Tirosin Kinasa de los compuestos de la invención, por lo que no se puede establecer que el objeto de esta invención pueda generar un efecto técnico mejorado o inesperado con respecto a lo divulgado en el Estado de la Técnica D2

En consecuencia, la reivindicación 1 según lo divulgado en D1 y D2, carece de Nivel Inventivo

Las reivindicaciones dependientes 2 a 6 no mencionan alguna característica inventiva a los compuestos de la reivindicación 1, por lo que se considera que también carecen de Nivel Inventivo.

8. Conclusión

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

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2006021454	1 a 6	Nivel Inventivo
D2	WO2006074057	1 a 6	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.

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.



JOSE LUIS SALAZAR LOPEZ
Director de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha
2 oct. 2012

Elaborado por: Alexander Ramírez Reyes
Revisado por: Gloria Jacqueline Alfonso *out*