

#36
1135

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-009530- -00003-0000

Fecha 2008-01-23 12:11:10 Dep 2020 NUECREACION
Tre 11 PATENTEIYII Eve 379 FASENACIONALI
Act 538 PETICION Folios 2

Ref.: Expediente N°. 06-009.530

**Solicitud de Patente de Invención Titulada: "PROCEDIMIENTO PARA LA
PREPARACION DE FRAGMENTOS DE C₁-C₁₅ DE EPOTILONAS Y SUS
DERIVADOS"**

Solicitante: SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT

**SOLICITUD DE EXAMEN DE PATENTABILIDAD SEGÚN
EL ARTÍCULO 44 DE LA DECISION 486, GACETA No. 578**

J. IAN RAISBECK, mayor de edad y vecino de Bogotá, D.C., identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi carácter de apoderado de la sociedad solicitante, respetuosamente me permito solicitar que se examine si la invención reúne los requisitos de patentabilidad previstos en la misma, dando cumplimiento a lo establecido en el artículo 44 de la Decisión 486 de la comisión de la Comunidad Andina. Adjunto recibo por el monto de \$210.000 pesos para cubrir la tasa correspondiente, según la Resolución No. 44372 del 26 de Diciembre de 2007.

Atentamente,

J. IAN RAISBECK
C.C. 79.376.996 de Bogotá
T.P. 135.799

Anexo: Recibo por \$210.000 pesos

LMB/P2006/000168 080116 Sol Exam

138
137

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No. 06-09530

EL EXTRACTO DE LA PRESENTE SOLICITUD DE **PATENTE DE INVENCION**

FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No **578** DE

FECHA **31 DE JULIO DE 2007** EL TÉRMINO HÁBIL SEÑALADO POR LA LEY

EXPIRA EL **26 DE OCTUBRE DE 2007**

NOTA: Dentro del plazo de los seis (6) meses siguientes a partir de la fecha de publicación en la gaceta de Propiedad Industrial, deberá solicitar y cancelar el examen de patentabilidad so pena de que la solicitud caiga en abandono, de acuerdo con lo establecido en el Artículo 44 de la Decisión 486/2000.

SE PRESENTARON OPOSICIONES POR PARTE DE TERCEROS.

SI _____

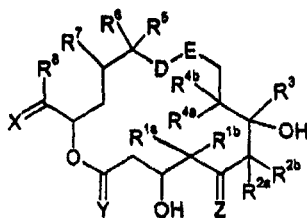
NO X

139
 138

(51) Internationale Patentklassifikation ⁶ : C07D 313/00, 493/04, C07C 59/185, A61K 31/335 // (C07D 493/04, 313:00, 303:00)		A2	(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 99/07692 (43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 18. Februar 1999 (18.02.99)																					
(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP98/05064 (22) Internationales Anmeldedatum: 10. August 1998 (10.08.98) (30) Prioritätsdaten: <table border="0"> <tr><td>197 35 574.9</td><td>9. August 1997 (09.08.97)</td><td>DE</td></tr> <tr><td>197 35 575.7</td><td>9. August 1997 (09.08.97)</td><td>DE</td></tr> <tr><td>197 35 578.1</td><td>9. August 1997 (09.08.97)</td><td>DE</td></tr> <tr><td>197 48 928.1</td><td>24. Oktober 1997 (24.10.97)</td><td>DE</td></tr> <tr><td>197 49 717.9</td><td>31. Oktober 1997 (31.10.97)</td><td>DE</td></tr> <tr><td>197 51 200.3</td><td>13. November 1997 (13.11.97)</td><td>DE</td></tr> <tr><td>198 13 821.0</td><td>20. März 1998 (20.03.98)</td><td>DE</td></tr> </table> (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; Müllerstrasse 178, D-13353 Berlin (DE). (72) Erfinder; und (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): KLAR, Ulrich [DE/DE]; Isegrimsteig 8a, D-13503 Berlin (DE). SCHWEDE, Wolfgang [DE/DE]; Klosterheider Weg 35, D-13467 Berlin (DE). SKUBALLA, Werner [DE/DE]; Mattersburger Weg 12, D-13465 Berlin (DE). BUCHMANN, Bernd [DE/DE]; Erdmannstrasse 44, D-16540 Hohen Neuendorf (DE).		197 35 574.9	9. August 1997 (09.08.97)	DE	197 35 575.7	9. August 1997 (09.08.97)	DE	197 35 578.1	9. August 1997 (09.08.97)	DE	197 48 928.1	24. Oktober 1997 (24.10.97)	DE	197 49 717.9	31. Oktober 1997 (31.10.97)	DE	197 51 200.3	13. November 1997 (13.11.97)	DE	198 13 821.0	20. März 1998 (20.03.98)	DE	SCHIRNER, Michael [DE/DE]; Eichenstrasse 51, D-13156 Berlin (DE). (81) Bestimmungsstaaten: AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DK, EE, ES, FI, GB, GE, GH, GM, HU, ID, IL, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZW, ARIPO Patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG). Veröffentlicht Ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu veröffentlichen nach Erhalt des Berichts.	
197 35 574.9	9. August 1997 (09.08.97)	DE																						
197 35 575.7	9. August 1997 (09.08.97)	DE																						
197 35 578.1	9. August 1997 (09.08.97)	DE																						
197 48 928.1	24. Oktober 1997 (24.10.97)	DE																						
197 49 717.9	31. Oktober 1997 (31.10.97)	DE																						
197 51 200.3	13. November 1997 (13.11.97)	DE																						
198 13 821.0	20. März 1998 (20.03.98)	DE																						

(54) Title: NEW EPOTHILONE DERIVATIVES, METHOD FOR PRODUCING SAME AND THEIR PHARMACEUTICAL USE

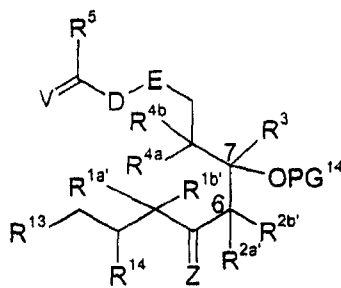
(54) Bezeichnung: NEUE EPOTHILON-DERIVATE, VERFAHREN ZU DEREN HERSTELLUNG UND IHRE PHARMAZEUTISCHE VERWENDUNG



49

Darstellung der Teilfragmente ABC und deren Zyklisierung zu I:

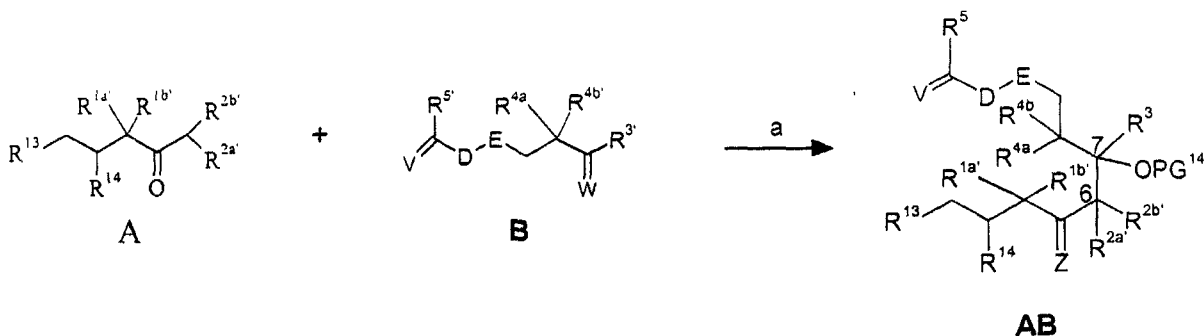
Teilfragmente der allgemeinen Formel AB



AB,

worin R^{1a'}, R^{1b'}, R^{2a'}, R^{2b'}, R³, R^{4a}, R^{4b}, R⁵, R¹³, R¹⁴, D, E, V und Z die bereits genannten Bedeutungen haben und PG¹⁴ ein Wasserstoffatom oder eine Schutzgruppe PG darstellt, werden aus den zuvor beschriebenen Fragmenten A und B nach dem in Schema 8 gezeigten Verfahren erhalten.

Schema 8



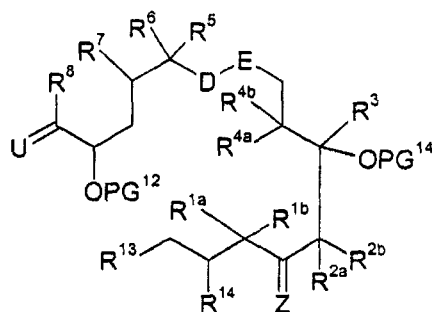
Schritt a (A + B → AB):

Die Verbindung B, worin W die Bedeutung eines Sauerstoffatoms hat und eventuell vorhandene zusätzliche Carbonylgruppen geschützt sind, wird mit dem Enolat einer Carbonylverbindung der allgemeinen Formel A alkyliert. Das Enolat wird durch Einwirkung starker Basen wie z.B. Lithiumdiisopropylamid, Lithiumhexamethyldisilazan bei niedrigen Temperaturen hergestellt.

Teilfragmente der allgemeinen Formel ABC

140
139

50

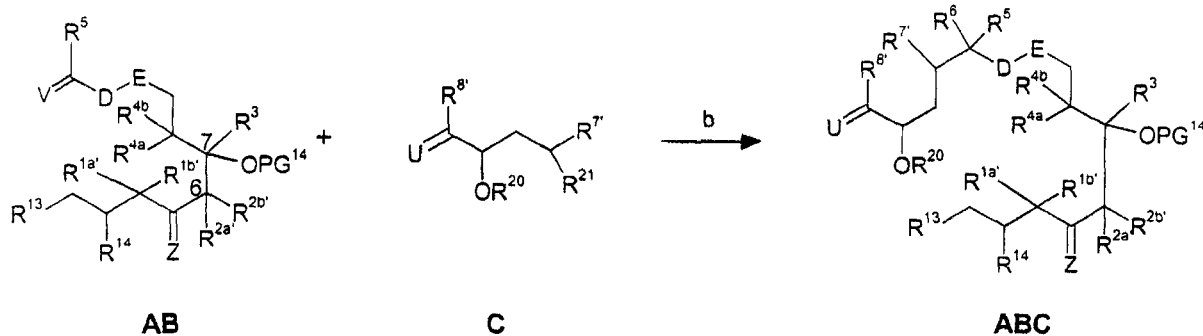


ABC,

worin R^{1a'}, R^{1b'}, R^{2a'}, R^{2b'}, R³, R^{4a}, R^{4b}, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R¹³, R¹⁴, D, E, U und Z die bereits genannten Bedeutungen haben, werden aus den zuvor beschriebenen Fragmenten AB und C nach dem in Schema 9 gezeigten Verfahren erhalten.

5

Schema 9



10 Schritt b (AB + C $\rightarrow$ ABC):

Die Verbindung C, in der R²¹ die Bedeutung eines Wittigsalzes hat und eventuell vorhandene zusätzliche Carbonylgruppen geschützt sind, wird durch eine geeignete Base wie z.B. n-Butyllithium, Lithiumdiisopropylamid, Kalium-tert.butanolat, Natrium- oder Lithium-hexamethyldisilazid deprotoniert und mit einer Verbindung AB, worin V die Bedeutung eines Sauerstoffatoms hat, umgesetzt.

15

Schritt c (ABC $\rightarrow$ I):

Die Verbindungen ABC, in denen R¹³ eine Carbonsäure CO₂H und R²⁰ ein Wasserstoffatom darstellt, setzt man nach den, dem Fachmann bekannten Methoden für die Bildung großer Macrolide zu Verbindungen der Formel I, in denen Y die Bedeutung eines Sauerstoffatoms besitzt, um. Bevorzugt wird die in "Reagents for Organic Synthesis, Vol. 16, p 353" beschriebene Methode unter Verwendung von 2,4,6-Trichlorbenzoesäurechlorid und geeigneten Basen wie z.B. Triethylamin, 4-Dimethylaminopyridin, Natriumhydrid.

20

25

141 140

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES**

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
J. IAN RAISBECK

ASUNTO	Radicación	06-009530
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio	
	Folios	NO 15340

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Vía Nacional	☐		
Vía PCT (fase nacional)	☒	Cap. I	☐
		Cap. II	☒

No. Sol. Internacional	PCT/EP2004/006685
Fecha de Presentación Internal.	19-06-2004

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: 41 a 102	(como se radicó inicialmente)
<u>Reivindicaciones:</u>	Folios 103 a 111	(como se radicó inicialmente)
<u>Prioridad:</u>	Fecha: 3-07-2003; país y número: DE 10331004.5.	

2. Objeto de la Invención

Título de la invención: "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACIÓN DE FRAGMENTOS DE C₁-C₁₅ DE EPOTILONAS Y SUS DERIVADOS"

Problema Técnico Planteado: la síntesis de epotilonas

Solución: una preparación del fragmento de epotilona C₁-C₁₅ de la fórmula general (I).

IPC: C07C45/67; C07C49/17; C07D417/06.

3. De la solicitud de Patente

a. Descripción (artículo 28 D. 486)

La descripción no presenta las figuras del esquema 2 del folio 55.

b. Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

La reivindicación 1 hace referencia en el folio 105 a la fórmula general A, pero la figura no fue adjuntada.

La formula general II de la reivindicación 4 esta incompleta.

Concluir indicando que no cumplen con el requisito de definición, claridad, concisión o sustento por la descripción de acuerdo al art. 30 de la Decisión 486.y/o art.22 Tratado PCT.

4. Unidad de invención (artículo 25 D 486)

La solicitud presenta dos conceptos inventivos diferentes a saber:

- 1. Procedimiento para la preparación de fragmentos de epotilona de fórmula general (I) e intermediarios. reivindicaciones 1 a 3 y 5
- 2. Procedimiento para la preparación de los derivados de epotilona de fórmula general (II). Reivindicación 4.

En consecuencia, la solicitud carece de unidad de invención.

5. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha que se ha tenido en cuenta para determinar el Estado de la Técnica es:

Fecha de presentación de la solicitud prioritaria

Teniendo en cuenta la fecha indicada se realizó la búsqueda en el estado de la técnica de documentos relacionados con la solicitud encontrándose los siguientes documentos más relevantes:

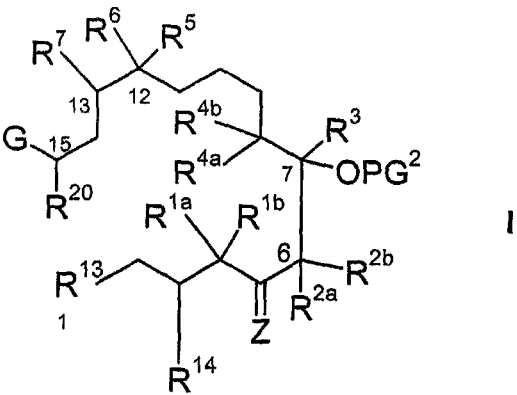
Nº	Documento	Título	Fecha de publicación*
D1	WO99/07692	NEW EPOTHILONE DERIVATIVES, METHOD FOR PRODUCING SAME AND THEIR PHARMACEUTICAL USE	18-02-1999

6. Análisis de Patentabilidad (Art 14 D486)

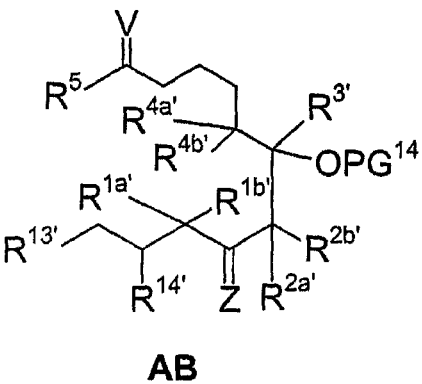
Novedad (Art 16 D486)

La presente evaluación de novedad se refiere al grupo inventivo número 1, de las reivindicaciones 1 a 3 y 5.

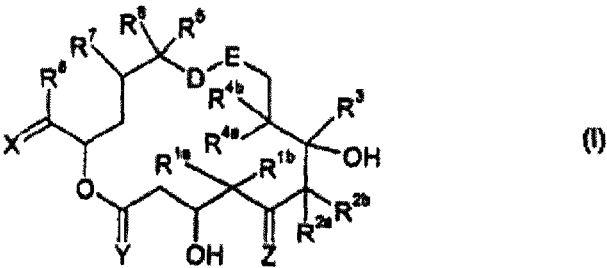
La reivindicación 1 reclama un procedimiento para la preparación de fragmentos de epotilona C₁₋₅ de la fórmula general I.



La reivindicación 5 reclama compuestos de la fórmula general AB:



D1 divulga nuevas epotilonas derivadas de la fórmula general (I), y su procedimiento de síntesis:



Características esenciales de	D1
-------------------------------	----

Características esenciales de la Solicitud	D1 WO99/07692
1. Hacer reaccionar un fragmento de C1-C6 de la forma general A: A	Schema 8 AB Página 49 esquema 8
2. Con un fragmento C7-C12 de la fórmula general: B	
3. Para obtener la fórmula general AB: AB	
4. El fragmento de la fórmula general AB se hace reaccionar con un fragmento de C13-C15 de la fórmula general C: C	Schema 9 ABC Página 50, esquema 9
5. Obtener un compuesto de fórmula general A-B-C: ABC	

Como se evidencia en la tabla anterior el proceso divulgado por D1 divulga la preparación de derivados de epotilona a partir de los fragmentos $A+B = A-B$ y $A-B + C = A-B-C$. Por lo tanto la necesidad de un método para obtener epotilonas ya se había resuelto mediante el mismo conjunto de reacciones en D1. Por lo tanto las reivindicaciones 1 a 3 y 5 carecen de novedad.

7. Conclusión

Los requisitos de Patentabilidad de la presente Solicitud se encuentran afectados así:

N°	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO99/07692	1-3 y 5	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 numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única N° 10 de 2001.


ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
 Directora de Nuevas Creaciones (C)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha
26 NOV. 2010

CONCEPTO TÉCNICO No.3468	EXAMINADOR TÉCNICO Código No. 202073
------------------------------------	--