

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO			
RAD: 12-133089- -4	FECHA: 2013-10-15 13:58:47		
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I		
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 9		
ACT: 519 PRESENTACION			

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
DILIA MARIA RODRIGUEZ D ALEMAN

Asunto: Radicación: 12-133089- -4
Trámite: 11
Evento: 378
Actuación: 519
Oficio: 19471
Folios: 9

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/US2011/020534				
Fecha de Presentación Internacional	07/01/2011				

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:	Radicado No. 12-133089-00000-0000	08/Agosto/2012
Reivindicaciones:	Radicado No. 12-133089-00000-0000	08/Agosto/2012
Dibujos:	Radicado No. 12-133089-00000-0000	08/Agosto/2012
Prioridad:	US 61/293,396	08/Enero/2010
	US 61/294,578	13/Enero/2010

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.

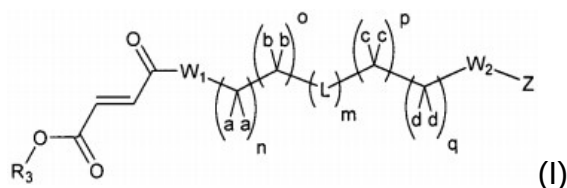
3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: “Derivados de fumarato de ácido grasos y sus usos”

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar compuestos derivados de fumarato de ácidos grasos.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un conjugado molecular que comprende un fumarato y un ácido graso seleccionado

de ácido lipoico, ácidos grasos omega-3 o ácidos grasos metabolizados in vivo en ácidos grasos omega-3 y, un compuesto de la fórmula I:



El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A01N37/00//37/18.

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

El objeto de las reivindicaciones 15 a 20 no es patentable de acuerdo con el Art citado.

5. De la Solicitud de Patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 no es clara, ni concisa cuando emplea el término “conjugado molecular” sin definir la estructura química del mismo. Da lugar a un número indeterminado de compuestos que no encuentran soporte en la descripción. Se sugiere eliminar la reivindicación del pliego reivindicatorio.

La reivindicación 1 no es clara ni concisa cuando emplea los términos “ácidos grasos omega-3” o “ácidos grasos metabolizados in vivo en ácidos grasos omega-3” sin definir concretamente cuáles son los ácidos grasos que den lugar a los compuestos de la invención. Asimismo, da lugar a un número indeterminado de compuestos que no encuentran soporte en la descripción. Se sugiere eliminar la reivindicación del pliego reivindicatorio.

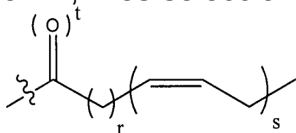
Las reivindicaciones 2, 3, 10, 11 y 12 no son claras cuando emplean los términos “opcionalmente sustituido” para definir los sustituyentes de la invención porque no delimita, ni enseña el objeto de la invención, asimismo, da lugar a una infinidad de compuestos que no encuentran soporte en la descripción. Se sugiere definir los radicales y sustituyentes de manera precisa de tal manera que pueda definirse claramente el objeto de la invención, así como restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que ha sido sintetizado o probado, es decir, que se encuentran debidamente soportados.

Las reivindicaciones 2, 3, 10, 11 y 12 no son claras cuando emplean los términos “cicloalquilo”, “heterociclo” o “heteroarilo”, “-O-arilo” porque no se define el número de átomos de carbono o de miembros que los conforman, y para los “hetero” no se definen los heteroátomos que los conforman dando lugar a un número indeterminado de compuestos que no encuentran soporte en la descripción. Se sugiere definir los radicales de manera precisa de tal manera que pueda definirse claramente el objeto de la invención, así como restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que ha sido sintetizado o probado, es decir, que se encuentran debidamente soportados.

Las reivindicaciones 2, 3, 10, 11 y 12 no son claras cuando emplean los términos “hidratos”, “solvatos” o “profármacos” sin caracterizarse apropiadamente, esto teniendo en cuenta que los hidratos y solvatos son pseudopolimorfos y, lo mismo

que los polimorfos, su caracterización se hace mediante el patrón de difracción de rayos X en mono cristal, el patrón de difracción de rayos X en polvo (DRXP) con por lo menos los 20 picos correspondientes a las intensidades de los haces difractados o a los espacios interplanares d_{hkl} según los índices de Miller (hkl) medidos de acuerdo con el ángulo de difracción de Bragg 2θ en el intervalo más representativo comprendido entre 5° hasta 90° , las espectroscopías Raman e IR, la espectroscopía RMN- C^{13} , o, los métodos de análisis térmico: TGA, DTA y DSC. Asimismo, no se encuentra soporte en la descripción que se haya obtenido algún solvato, hidrato o polimorfo de los compuestos de la invención, por lo que se solicita eliminar estos términos del pliego reivindicatorio.

El capítulo reivindicatorio no está soportado en la descripción porque no hay suficientes ejemplos que demuestren que se hayan obtenido los compuestos de formula (I). Se encuentra soporte preferentemente para los siguientes sustituyentes: R^3 es metilo o etilo; W^1 es $-NH-$, $-N-Me$ o $-C(O)-$; W^2 es $-NH-$ o está ausente, o W^1 y W^2 se unen para formar una anillo de piperazinilo opcionalmente sustituido con dos grupos metilo; n , o , p y q son independientemente 0 o 1; a y b son independiente mente seleccionados de H, $COOH$ o $COOMe$; c y d son H; L es seleccionado de $-N(H)-$, $-N(H)C(O)-$, $-N(Me)-$,

$-S(Me)-$, O , o , $-S-S$; Z es , donde r es 2 y s es 6. Se solicita restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que ha sido sintetizado ó probado, es decir, que se encuentran debidamente sustentados.

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 08 de enero de 2010 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	US6956059	Anti-inflammatory and immunomodulatory amino acid derivatives, their preparation and use	02/Diciembre/2004
D2	US5242905	Pharmaceutical compositions for the treatment of psoriasis	07/Septiembre/1993

D1 http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2004242663A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20041202&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP, divulga (todo el documento) un conjugado molecular con actividad antiinflamatoria que comprende un aminoácido como lisina conjugado a ácidos grasos como omega 3.

D2 http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=5242905A&KC=A&FT=D&ND=3&date=19930907&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP, divulga (Col. 2, líneas 49-54) un conjugado molecular que comprende lisina y fumarato para el tratamiento de psoriasis

7. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en un conjugado molecular que comprende un fumarato y un ácido graso seleccionado de ácido lipoico, ácidos grasos omega-3

o ácidos grasos metabolizados in vivo en ácidos grasos omega-3.

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

Características esenciales	D1	D2
Conjugado molecular que comprende:	Conjugado molecular que comprende:	Conjugado molecular que comprende:
	Lisina	Lisina
un fumarato y	No se menciona	un fumarato y
un ácido graso seleccionado de ácido lipoico, ácidos grasos omega-3 o ácidos grasos metabolizados in vivo en ácidos grasos omega-3.	un ácido graso seleccionado de ácidos grasos omega-3 (Col. 2, líneas 40-59)	No se menciona

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga un conjugado molecular con actividad antiinflamatoria que comprende un aminoácido como lisina conjugado a ácidos grasos como omega 3.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el conjugado de D1 consiste en que comprende además un fumarato.

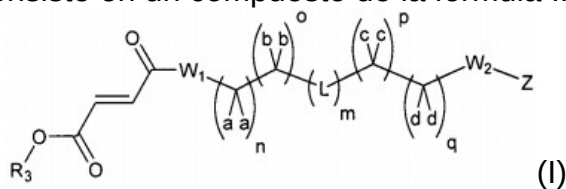
Esta diferencia no parece conceder un efecto técnico inesperado o una ventaja a los conjugados reclamados en esta solicitud ya que no parecen presentar propiedades antiinflamatorias superiores en comparación con los conjugados del estado de la técnica cercano.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular como la necesidad de suministrar conjugados moleculares para el tratamiento de enfermedades inflamatorias alternativos a los conocidos en el estado del arte.

Sin embargo, la incorporación de un residuo fumarato en los conjugados moleculares para el tratamiento de enfermedades inflamatorias ya está divulgada en el documento D2 que se refiere a un conjugado molecular que comprende lisina y fumarato (Col. 2, líneas 49-54) para el tratamiento de psoriasis.

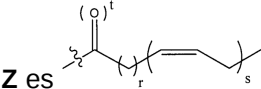
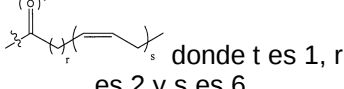
En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría el fumarato divulgado en D2, en los conjugados moleculares de D1, con la expectativa razonable de encontrar conjugados con propiedades antiinflamatorias mejoradas para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

La reivindicación 2 consiste en un compuesto de la fórmula I:



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

Características esenciales	D1	D2
Compuesto de la fórmula I:	Compuesto de la fórmula $\text{CH}_3-(\text{CH}_2)_7-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_{13}-\overset{\text{O}}{\underset{\text{O}}{\text{C}}}-\text{NH}-(\text{X})-\text{COOR}$ Donde X es R1-CH-Y, donde Y es NHR2 y R2 es un residuo de ácido docosahexaenoico, (Col. 3, líneas 60-65)	Compuesto de la fórmula:
R ₃ es H, alquilo C ₁ -C ₆ , -C(CH ₂ OH) ₂	CH ₃	H

Características esenciales	D1	D2
W_1 es cero, O, S, NH o NR	NH	No se menciona
a y b son H o CH_3	H	No se menciona
n y o son 0, 1 o 2	1	No se menciona
L es cero, O, CO, S, alquilo C_1 - C_6	$-CH_2-$	No se menciona
m es	1	No se menciona
c y d son H o CH_3	H o COOR, donde R es CH_3	No se menciona
p y q son 0, 1 o 2	1	No se menciona
W_2 es cero, O, S, NH o NR	NH	No se menciona
Z es 	 donde t es 1, r es 2 y s es 6.	No se menciona

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 2 porque divulga un conjugado molecular con actividad antiinflamatoria que comprende un aminoácido como lisina conjugado a ácidos grasos como omega 3.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el conjugado de D1 consiste en que comprende además un fumarato.

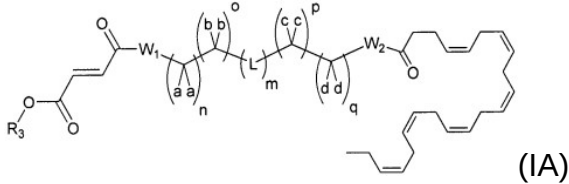
Esta diferencia no parece conceder un efecto técnico inesperado o una ventaja a los conjugados reclamados en esta solicitud ya que no parecen presentar propiedades antiinflamatorias superiores en comparación con los conjugados del estado de la técnica cercano.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular como la necesidad de suministrar conjugados moleculares para el tratamiento de enfermedades inflamatorias alternativos a los conocidos en el estado del arte.

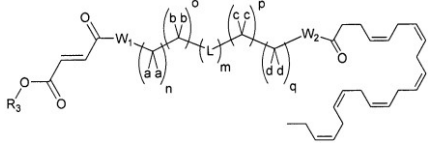
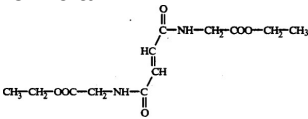
Sin embargo, la incorporación de un residuo fumarato en los conjugados moleculares para el tratamiento de enfermedades inflamatorias ya está divulgada en el documento D2 que se refiere a un conjugado molecular que comprende lisina y fumarato (Col. 2, líneas 49-54) para el tratamiento de psoriasis.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría el fumarato divulgado en D2, en los conjugados moleculares de D1, con la expectativa razonable de encontrar conjugados con propiedades antiinflamatorias mejoradas para llegar así al objeto de la reivindicación 2 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

La reivindicación 3 consiste en un compuesto de la fórmula IA:



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

Características esenciales	D1	D2
Compuesto de la fórmula IA: 	Compuesto de la fórmula: $CH_3-(CH_2)_7-CH=CH-(CH_2)_{13}-C(=O)-NH-(X)-COOR$ Donde X es R_1-CH-Y , donde Y es NHR_2 y R_2 es un residuo de ácido docosahexaenoico, (Col. 3, líneas 60-65)	Compuesto de la fórmula: 

Características esenciales	D1	D2
R ₃ es H, alquilo C ₁ -C ₆ , -C(CH ₂ OH) ₂	CH ₃	H
W ₁ es cero, O, S, NH o NR	NH	No se menciona
a y b son H o CH ₃	H	No se menciona
n y o son 0, 1 o 2	1	No se menciona
L es cero, O, CO, S, alquilo C ₁ -C ₆	-CH ₂ -	No se menciona
m es	1	No se menciona
c y d son H o CH ₃	H o COOR, donde R es CH ₃	No se menciona
p y q son 0, 1 o 2	1	No se menciona
W ₂ es cero, O, S, NH o NR	NH	No se menciona

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 3 porque divulga un conjugado molecular con actividad antiinflamatoria que comprende un aminoácido como lisina conjugado a ácidos grasos como omega 3.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el conjugado de D1 consiste en que comprende además un fumarato.

Esta diferencia no parece conceder un efecto técnico inesperado o una ventaja a los conjugados reclamados en esta solicitud ya que no parecen presentar propiedades antiinflamatorias superiores en comparación con los conjugados del estado de la técnica cercano.

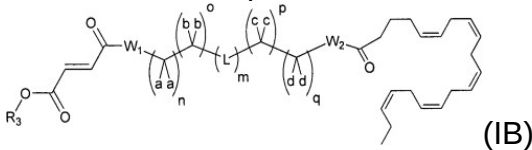
Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular como la necesidad de suministrar conjugados moleculares para el tratamiento de enfermedades inflamatorias alternativos a los conocidos en el estado del arte.

Sin embargo, la incorporación de un residuo fumarato en los conjugados moleculares para el tratamiento de enfermedades inflamatorias ya está divulgada en el documento D2 que se refiere a un conjugado molecular que comprende lisina y fumarato (Col. 2, líneas 49-54) para el tratamiento de psoriasis.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría el fumarato divulgado en D2, en los conjugados moleculares de D1, con la expectativa razonable de encontrar conjugados con propiedades antiinflamatorias mejoradas para llegar así al objeto de la reivindicación 3 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 3 - 9 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

La reivindicación 10 consiste en un compuesto de la fórmula IB:



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

Características esenciales	D1	D2
Compuesto de la fórmula IB: 	Compuesto de la fórmula: $\text{CH}_3-(\text{CH}_2)_7-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_{13}-\overset{\text{O}}{\underset{\text{ }}{\text{C}}}-\text{NH}-(\text{X})-\text{COOR}$ Donde X es R1-CH-Y, donde Y es NHR2 y R ₂ es un residuo de ácido graso poliinsaturado C ₁₈ -C ₂₄ , (Col. 3, líneas 56-60)	Compuesto de la fórmula:

Características esenciales	D1	D2
R ₃ es H, alquilo C ₁ -C ₆ , -C(CH ₂ OH) ₂	CH ₃	H
W ₁ es cero, O, S, NH o NR	NH	No se menciona
a y b son H o CH ₃	H	No se menciona
n y o son 0, 1 o 2	1	No se menciona
L es cero, O, CO, S, alquilo C ₁ -C ₆	-CH ₂ -	No se menciona
m es	1	No se menciona
c y d son H o CH ₃	H o COOR, donde R es CH ₃	No se menciona
p y q son 0, 1 o 2	1	No se menciona
W ₂ es cero, O, S, NH o NR	NH	No se menciona

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 10 porque divulga un conjugado molecular con actividad antiinflamatoria que comprende un aminoácido como lisina conjugado a ácidos grasos como omega 3.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el conjugado de D1 consiste en que comprende además un fumarato.

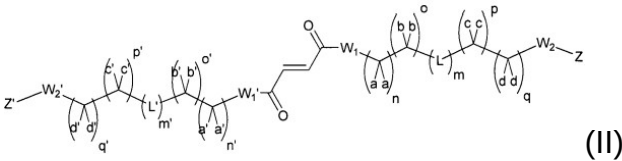
Esta diferencia no parece conceder un efecto técnico inesperado o una ventaja a los conjugados reclamados en esta solicitud ya que no parecen presentar propiedades antiinflamatorias superiores en comparación con los conjugados del estado de la técnica cercano.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular como la necesidad de suministrar conjugados moleculares para el tratamiento de enfermedades inflamatorias alternativos a los conocidos en el estado del arte.

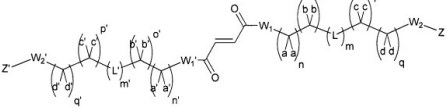
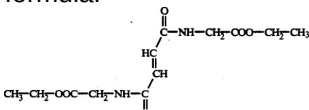
Sin embargo, la incorporación de un residuo fumarato en los conjugados moleculares para el tratamiento de enfermedades inflamatorias ya está divulgada en el documento D2 que se refiere a un conjugado molecular que comprende lisina y fumarato (Col. 2, líneas 49-54) para el tratamiento de psoriasis.

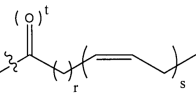
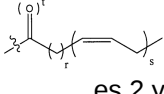
En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría el fumarato divulgado en D2, en los conjugados moleculares de D1, con la expectativa razonable de encontrar conjugados con propiedades antiinflamatorias mejoradas para llegar así al objeto de la reivindicación 10 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

La reivindicación 12 consiste en un compuesto de la fórmula II:



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

Características esenciales	D1	D2
Compuesto de la fórmula II: 	Compuesto de la fórmula: $\text{CH}_3-(\text{CH}_2)_7-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_{13}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{NH}-(\text{X})-\text{COOR}$ Donde X es R1-CH-Y, donde Y es NHR2 y R ₂ es un residuo de ácido graso poliinsaturado C ₁₈ -C ₂₄ , (Col. 3, líneas 56-60)	Compuesto de la fórmula: 
R ₃ es H, alquilo C ₁ -C ₆ , -C(CH ₂ OH) ₂	CH ₃	H
W ₁ es cero, O, S, NH o NR	NH	No se menciona
a y b son H o CH ₃	H	No se menciona

Características esenciales	D1	D2
n y o son 0, 1 o 2	1	No se menciona
L es cero, O, CO, S, alquilo C ₁ -C ₆	-CH ₂ -	No se menciona
m es	1	No se menciona
c y d son H o CH ₃	H o COOR, donde R es CH ₃	No se menciona
p y q son 0, 1 o 2	1	No se menciona
W ₂ es cero, O, S, NH o NR	NH	No se menciona
Z es 	 donde t es 1, r es 2 y s es 6.	No se menciona

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 12 porque divulga un conjugado molecular con actividad antiinflamatoria que comprende un aminoácido como lisina conjugado a ácidos grasos como omega 3.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el conjugado de D1 consiste en que comprende además un fumarato.

Esta diferencia no parece conceder un efecto técnico inesperado o una ventaja a los conjugados reclamados en esta solicitud ya que no parecen presentar propiedades antiinflamatorias superiores en comparación con los conjugados del estado de la técnica cercano.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular como la necesidad de suministrar conjugados moleculares para el tratamiento de enfermedades inflamatorias alternativos a los conocidos en el estado del arte.

Sin embargo, la incorporación de un residuo fumarato en los conjugados moleculares para el tratamiento de enfermedades inflamatorias ya está divulgada en el documento D2 que se refiere a un conjugado molecular que comprende lisina y fumarato (Col. 2, líneas 49-54) para el tratamiento de psoriasis.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría el fumarato divulgado en D2, en los conjugados moleculares de D1, con la expectativa razonable de encontrar conjugados con propiedades antiinflamatorias mejoradas para llegar así al objeto de la reivindicación 12 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

8. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	US6956059	1 – 10, 12 - 14	Nivel inventivo
D2	US5242905	1 – 10, 12 - 14	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 2013-10-22

Elaboró: Rubiela Pacanchique Vargas
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Roza