

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 12-171897- -4	FECHA: 2013-10-21 17:54:58
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 8
ACT: 519 PRESENTACION	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

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

Asunto: Radicación: 12-171897- -4
Trámite: 11
Evento: 378
Actuación: 519
Oficio: 19882
Folios: 8

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/CA2011/000320				
Fecha de Presentación Internacional	28/03/2011				

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:	Folios 107 a 169	01/Octubre/2012
Reivindicaciones:	Folios 170 a 187	01/Octubre/2012
Prioridades:	US61/318.824	30/Marzo/2010
	US61/321.573	07/Abril/2010

2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de prioridad porque ésta 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

De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del Capítulo Primero 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.

Título de la solicitud: "Inhibidores no nucleosídicos de la transcriptasa inversa".

El problema planteado en esta solicitud consiste en proporcionar compuestos con actividad inhibitoria transcriptasa inversa, inhibiendo la replicación del VIH.

El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 401/06 ; A61K 31/4439 y A61P 31/18.

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

El objeto de las reivindicaciones 25 – 26 no es patentable de acuerdo con el Art citado.

Dado que el objeto de las reivindicaciones reclama un método de tratamiento las cuales son consideradas excepciones a la patentabilidad, es necesario que sean eliminadas del capítulo de reivindicatorio.

5. De la solicitud de patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

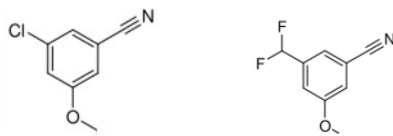
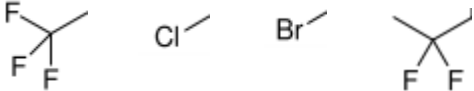
Las reivindicaciones 1-2 no son claras porque establecen un gran número de superíndices, que no permiten entender la materia reivindicada. No son claras porque dada su extensión no queda claro la diferencia entre las sustituciones. Por ejemplo el solicitante cita "ryX tiene independientemente la misma definición que AryQ, y HetX tiene independientemente la misma definición que HetQ;" lo cual no es claro para el examinador.

Las reivindicaciones 1-2 no son concisas, porque presentan una excesiva complejidad, lo cual dificulta determinar la extensión del objeto que se busca proteger dado que las reivindicaciones poseen un gran número de sustituyentes y posibles sustituciones.

Las reivindicaciones 24 y 25 no se encuentran sustentadas en le capítulo descriptivo, teniendo claro que una composición se define por ingredientes y proporciones.

Las reivindicaciones 1-10, 13-14 y 16 no son concisas ni se encuentran sustentadas porque las definiciones de R1, R2, R3,R4, R5, R^A, J incluyen géneros funcionales como: alquilos de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilos de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 Carbonos, O-Haloalquilo de C1-6,alquenilo, alquinilo, O alquilo, O haloalquilo, C(O)-haloalquilo, cicloalquenilo, heterociclo saturado o no, O-cicloalquilo, fluoroalquilo, heterobiciclilo, no es adecuada puesto que da lugar a un sinnúmero de posibilidades que no encuentran soporte en la descripción, frente a lo cual se sugiere definirlos por el nombre específico de los heteroarilos, heterociclos heterocicilos, hidroxialquilos, carboxi alquilos, alcoxilos y haloalquilos. A su vez se sugiere restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que ha sido sintetizado o probado, es decir, que se encuentran debidamente soportados.

En la descripción se encuentra soporte para las siguientes definiciones:

Sustituyentes	Preferencia del solicitante
R1	
R2	
R3	H, Br.
R4	H
R5	CH ₃ , -CH ₂ CH ₃

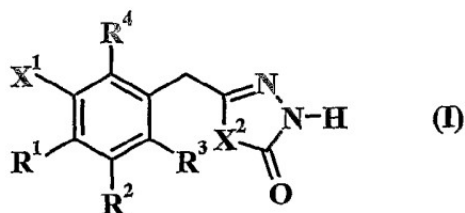
6. Determinación del Estado de la Técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de prioridad: marzo 15 de 2001, y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	WO2009067166	"Non-nucleoside reverse transcriptase inhibitors"	14 Noviembre 2008
D2	CA2518437	"Non-nucleoside reverse transcriptase inhibitors for treating HIV mediated diseases"	22 Marzo 2004

El documento D¹ divulga compuestos con actividad inhibitoria sobre la transcriptasa inversa, para inhibir la replicación del VIH que presentan el anillo pirimidínico y piridinilo (Pág. 2 Línea.35-37).

El documento D2 enseña compuestos que inhiben la transcriptasa inversa de tipo no nucleósido que presentan la fórmula (I) (Pág. 3 Línea.15-20).



7. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

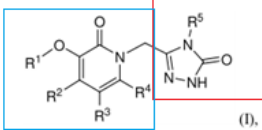
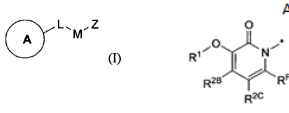
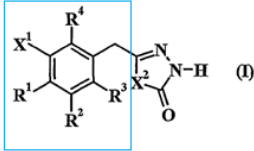
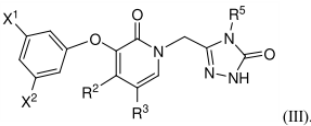
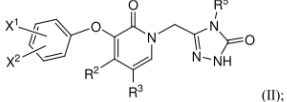
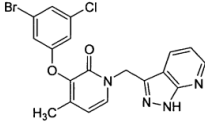
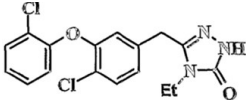
Nivel inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en "Un compuesto de fórmula (...)". Los compuestos de la reivindicación 1 son derivados de piridin-2-ona unido a triazona, que tienen

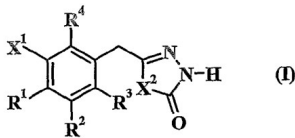
1 http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2009067166A2&KC=A2&FT=D&ND=3&date=20090528&DB=EPODOC&locale=en_EP.
2. http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=CA&NR=2518437A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20041007&DB=EPODOC&locale=en_EP

actividad inhibidora sobre la transcriptasa inversa y, por lo tanto, son útiles para tratar el VIH.

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

Características esenciales	D1	D2
Un compuesto (I)  (I).	Fórmula 1 (Pág. 2-3), A  (ii-c) L puede ser: un enlace simple entre A y M, O, N (RA), S, S(O), S(O) ₂ , CH ₂ , CH(CH ₃) o C(CH ₃) ₂ (Pág. 10 Línea 20-29) M puede ser un sustituyente CH ₂ , CH(CH ₃), CH(OH) o C(O)N(R ⁵) (Pág. 10 Línea 30) y Z puede ser G1, G2 o G3 (Pág. 10-11) entre ellos 	(Pág. 3 Fórmula 1) y X1 R ₅ O (Pág. 3 Línea 23)  (I)
R5 es H, hidrógeno o alquilo	No se menciona	X ₂ Puede ser NR ₇ (Pág. 3 Línea 23) y R ₇ es H o alquilo sustituido o no y
R1 es alquilo, cicloalquilo, arilo	R1 es alquilo, cicloalquilo, arilo con o sin fenilo (Pág. 5-7)	R5 fenilo, naftilo, piridinilo, pirazinilo, alquilo, cicloalquilo (Pág. 4 Líneas 5-7)
R2 y R3 hidrógeno, haloalquilo, halógeno, CN	R _{2B} y R _{2C} hidrógeno, haloalquilo, halógeno, CN, NO ₂ , SRA, cicloalquilo (Pág. 8-9)	R1 y R2 hidrógeno, haloalquilo, halógeno, CN (Pág. 3 Líneas 24-31)
R4 Puede ser hidrógeno, alquilo, halógeno, CN	R ₄ Puede ser hidrógeno, alquilo, halógeno, CN (Pág. 10 Línea. 9)	R3 puede ser hidrógeno, alquilo, halógeno, CN (Pág. 3 Líneas 33-35)
Reivindicación 16 y 19  (III).  (II);	Ejemplo 11-6 	Ejemplo 20  4g

Como se dijo anteriormente, los documentos D1 y D2 son considerados el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque el documento D1 divulga compuestos con actividad inhibidora sobre la transcriptasa inversa, para inhibir la replicación del VIH que presentan el anillo pirimidínico y piridinilo (Pág. 2 Línea 35-37), los cuales presentan valores de inhibición de propagación viral CIC₉₅ entre 2 a 638nM (Pág. 127 Tabla C), en cuanto el documento D2 enseña compuestos inhibidores de la transcriptasa inversa de tipo no nucleosídico que presentan la fórmula (I) (Pág. 3 Línea.15-20).



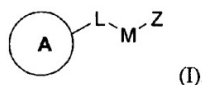
La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1, y los compuestos divulgados en el documento D1 consiste en que el anillo heterocíclico unido a la piridin-2-ona es triazolil-2-ona.

En cuanto a la diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1, y los compuestos divulgados en el documento D2 consiste en que el anillo de triazolil-2-ona se encuentra unido a un anillo de benceno, es decir, corresponde a un benzofusionado.

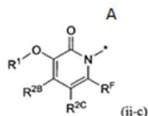
El efecto que logra el incluir el anillo triazolil-2-ona en la posición 1 del anillo de 2 piridin-2-ona, es obtener compuestos alternativos inhibidores de la transcriptasa inversa de tipo nucleosídico con valores de CIC₉₅ de 10 a 19nM (Fls. 169).

El problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: cómo diseñar compuestos alternativos que presenten mejores valores de IC_{95} frente a la inhibición de la transcriptasa inversa que actúa en la fase de la replicación del virus del VIH.

Ahora bien, teniendo en cuenta que el documento D1 divulga compuestos inhibidores de la transcriptasa inversa que tienen fórmula (I) (Págs. 2-3),

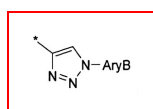


Donde A puede ser

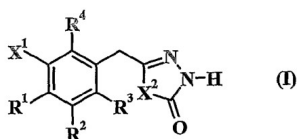


y que además L puede ser: un enlace

simple entre A y M, O, N(RA), S, S(O), S(O)₂, CH₂, CH(CH₃) o C(CH₃)₂ (Pág.10 Línea 20-29) y que M puede ser un sustituyente CH₂, CH(CH₃)₂, CH(OH) o C(O)N(R^A) (Pág.10 Línea 30) y Z puede ser G1, G2 o G3 (Págs.10-11) entre ellos:



Y que la serie divulgada presenta actividad inhibidora de la transcriptasa inversa, con valores de inhibición de propagación viral IC_{95} entre 2 a 638nM (Pág. 127 Tabla C). En cuanto al documento D2 se tiene que divulga compuestos inhibidores de la transcriptasa inversa de tipo no nucleosídicos que presentan la fórmula (I) (Pág. 3 Línea.15-20):



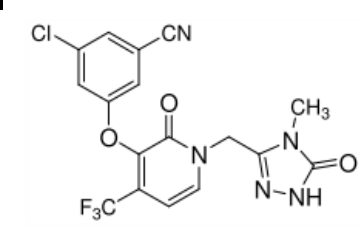
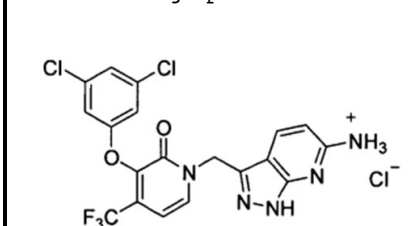
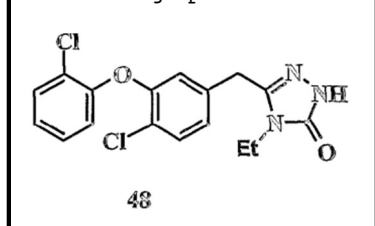
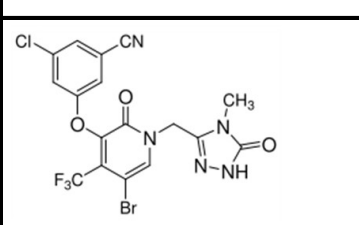
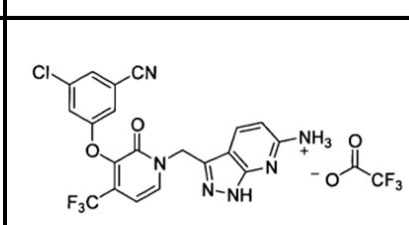
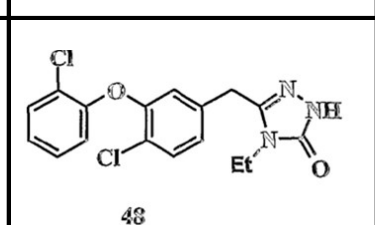
que tienen en la posición X1 sustituciones como: R₅O (Pág. 3 Línea 23), donde R₅ puede ser el sustituyente fenilo, naftilo, piridinilo, pirazinilo, alquilo o cicloalquilo (Pág. 4 Líneas 5-7), donde X2 puede ser NR₇ (Pág. 3 Línea 23) y R₇ es H o alquilo sustituido o no, donde X2 puede ser el sustituyente NR₇ (Pág. 3 Línea 23) y R₇ es H o un alquilo sustituido o no, R₁ y R₂ pueden ser hidrógeno, haloalquilo, halógeno o CN (Pág. 3 Líneas 24-31) y donde R₃ puede ser hidrógeno, alquilo, halógeno o CN (Pág. 3 Líneas 33-35). Por lo tanto, una persona versada en la materia plantearía modificaciones estructurales a partir de las enseñanzas del documento D1, incluyendo anillos heterocíclicos específicamente la triazolil-ona como se divulga en el documento D2, con la expectativa razonable de obtener una serie de compuestos alternativos con actividad inhibidora sobre la transcriptasa inversa y de esta forma llegar al objeto de la solicitud.

Lo anterior considerando que según las relaciones estructura actividad, es obvio para una persona en la materia plantear modificaciones estructurales, que van a conllevar cambios en la actividad de las moléculas, pero que de acuerdo a los valores de inhibición presentados por la solicitante se observa que dicha modificación no genera una mejora del valor de inhibición frente a los compuestos divulgados en el documento D1 cuyos valores de IC_{95} oscilan entre 2 a 638nM, comparados con los de la solicitud que presentan valores de IC_{95} de 10 a 19 nM. Además una persona versada en la materia buscaría compuestos con estructura similar a los ya conocidos y de acuerdo a los estudios QSAR teniendo en cuenta las características de los sustituyentes: efectos estéricos, efectos conformacionales, electrónicos y lipofílicos y plantearía modificaciones en los sustituyentes sin afectar las características del grupo farmacofórico ya conocido.

Por lo anterior, es claro que tanto los documentos D1 como D2 divulgan compuestos con actividad inhibitoria sobre la transcriptasa inversa por inhibición de la actividad ADN polimerasa dependiente de ARN.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 a 24 y 27 no mencionan características adicionales, se considera que tales reivindicaciones tampoco tienen nivel inventivo.

Sumado a lo anterior se presenta una tabla de comparación entre compuestos específicos divulgados respecto a los de la invención.

Com puestos de la invención	D1	D2
	Ejém pto 20-3 	Ejém pto 20  48
		 48

En conclusión, la reivindicación 1 cumple el requisito de novedad (Art. 16) pero no con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

8. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2009067166	1-27	Nivel inventivo
D2	CA2518437	1-27	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 2013-10-29

Elaboró: Diego Armando Galvis Sanchez
Revisó: Consuelo Leguizamon Leguizamon