

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 12-163009- -3	FECHA: 2013-12-19 13:17:45
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 7
ACT: 519 PRESENTACION	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO

Asunto: Radicación: 12-163009- -3
 Trámite: 11
 Evento: 378
 Actuación: 519
 Oficio: 23360
 Folios: 7

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/JP2011/054404				
Fecha de Presentación Internacional	25/02/2011				

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 12-163009-00000-0000	20/septiembre/2012
Reivindicaciones:	Radicado 12-163009-00000-0000	20/septiembre/2012
	Radicado 12-163009-00002-0000	23/mayo/2013
Prioridades:	JP 043567/2010	26/febrero/2010
	US 61/339,729	09/marzo/2010

2. Análisis de la Prioridad

Se acepta las reivindicaciones de las prioridades porque ésta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de las prioridades reivindicadas.

3. Objeto de la invención

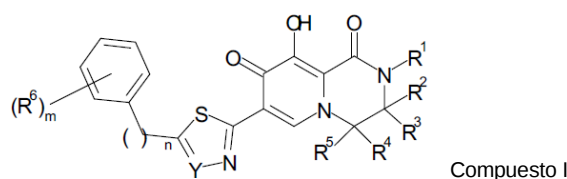
De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del capítulo primero del Título 10 de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por la solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es que cuando la solicitud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

cubiertas por la tasa pagada. En el presente caso se estudiarán las reivindicaciones 1 a 43 del capítulo reivindicatorio radicado bajo N° 12-163009-00002-0000)

Título de la solicitud: “Derivado de 1,3,4,8-tetrahidro-2*H*-pirido[1,2-*a*]pirazina y su uso como inhibidor de la integrasa del VIH”

El problema planteado en esta solicitud consiste en proporcionar compuestos anti-VIH que tiene una actividad inhibidora de la integrasa.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de fórmula (I) junto con las composiciones que lo comprenden:



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 471/04, A61K 31/4985, 31/5377, A61P 31/18 y 43/00.

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

El objeto de las reivindicaciones 37 a 39 no es patentable, de acuerdo con el Art citado.

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

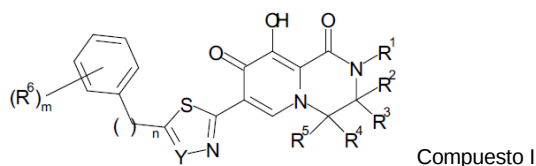
El uso de las reivindicaciones 35 y 36 no son patentables, de acuerdo con el Art 14.

6. De la solicitud de patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 no es clara ni concisa porque la utilización de las expresiones “opcionalmente sustituido.” para definir un sustituyente hace que radicales como alquilo C₁₋₆ presenten una excesiva complejidad, lo cual dificulta determinar la extensión del objeto que se busca proteger, se sugiere restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que ha sido sintetizado ó probado, es decir, que se encuentran debidamente sustentados.

La reivindicación 31 no es clara porque hacen referencia a la reivindicación 1 pero la reivindicaciones 1 no hace referencia a una composición farmacéutica sino que revela un compuesto de fórmula (I)



Por lo tanto, existe una falsa dependencia de la reivindicación 31.

Las reivindicaciones 32 a 34 no son claras ni concisas porque definen un producto en términos de su función o actividad farmacológica, se sugiere a la solicitante sustituir las expresiones “un agente anti-VIH” y “un inhibidor de la integrasa del VIH”

Las reivindicaciones 42 y 43 no son claras ni concisas porque las características esenciales de un estuche o kits son: 1.) las composiciones farmacéuticas que están presentes, 2.) la forma de administración de cada una de las composiciones que comprende, 3.) las instrucciones para la administración de cada una de las

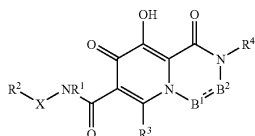
composiciones para conseguir el efecto deseado, 4.) la cantidad de dosificación a ser administrada en un tiempo determinado y 5.) el envase, recipiente o contenedor. Se sugiere al solicitante incluir todas las características técnicas esenciales necesaria para definir el kit o estuche reclamado de la manera previamente mencionada y que se encuentran debidamente soportadas en la descripción.

7. 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 más antigua: febrero 26 de 2010 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

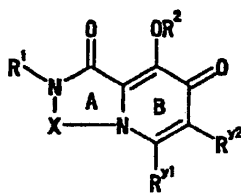
Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	US2009/0143356	"Polycyclic carbamoylpyridone derivative having HIV integrase inhibitory activity"	09/junio/2009
D2	ES2315700	"Compuesto de anillos condensados que contiene nitrógeno y su uso como inhibidor de integrasa de VIH"	22/junio/2006

El documento D1^[1] divulga compuestos derivados de la 9-hidroxi-1,8-dioxo-1,3,4,8-tetrahidro-2H-pirido[1,2-a]pirazina-7-carboxamida inhibidores de la integrasa del VIH de fórmula (I)



(Pág. 1, resumen)

El documento D2^[2] divulga compuestos de fórmula [I]-1 derivados de la 9-hidroxi-1,8-dioxo-1,3,4,8-tetrahidro-2H-pirido[1,2-a]pirazina, útiles como inhibidores de la integrasa del VIH

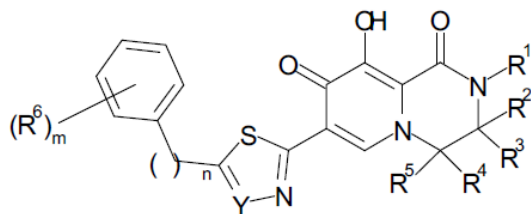


(Pág. 1, líneas 20 a 30)

8. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel inventivo (Art 18 D486)

La reivindicación 1 consiste en: "Un compuesto representado por la siguiente fórmula [I] ... " (Pág. 5 del radicado N°. 12-163009--00002-0000).



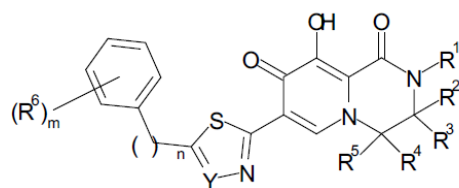
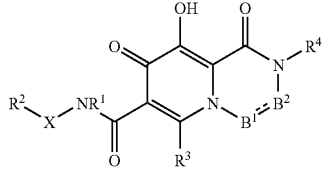
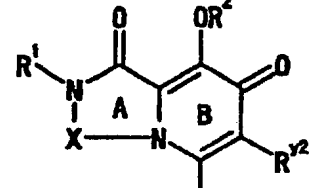
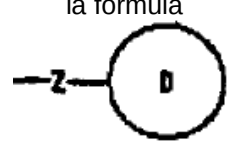
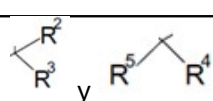
Compuesto I

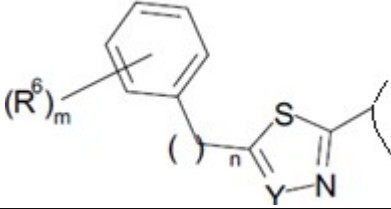
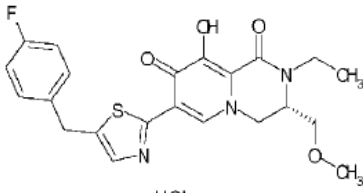
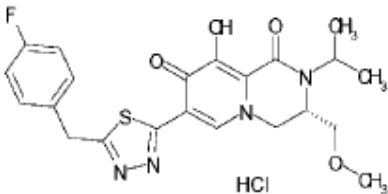
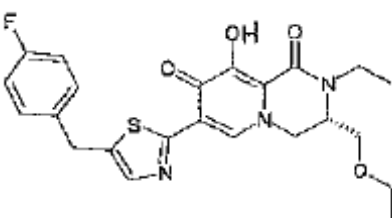
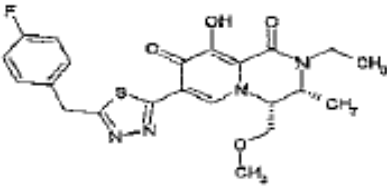
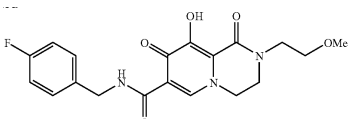
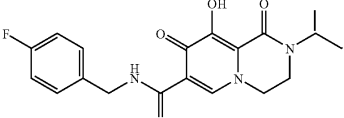
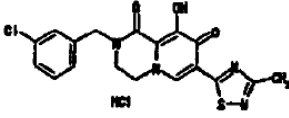
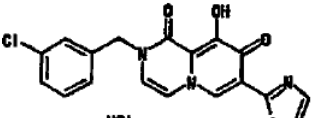
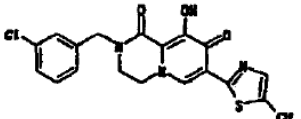
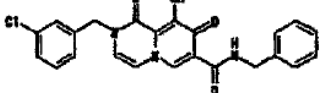
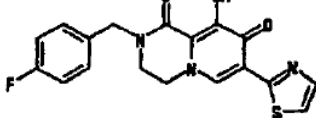
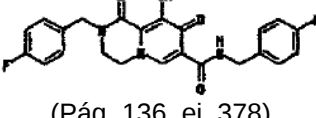
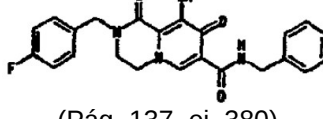
Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

1: <http://www.google.com/patents/US20090143356>

2: [http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20090401&CC=ES&NR=2315700T3&KC=T3)

DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20090401&CC=ES&NR=2315700T3&KC=T3

Características esenciales	D1	D2
Un compuesto de fórmula (I)  Compuesto I	Un compuesto de fórmula (I)  Compuesto I (Pág. 1, resumen)	Un compuesto de fórmula (I)  (Pág. 1, líneas 20 a 30)
R ¹	R ⁴	R ¹
es (1) un grupo alquilo de C₁₋₆ opcionalmente sustituido con 1 a 5 sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de (i) un grupo cicloalquilo de C₃₋₈, y (ii) un grupo alcoxi de C₁₋₆, (2) un grupo cicloalquilo de C₃₋₈, o (3) un grupo heterocíclico monocíclico saturado que contiene, además de átomos de carbono, 1 a 3 heteroátomos seleccionados de un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre.	hidrógeno, alquilo inferior opcionalmente sustituido, cicloalquilo opcionalmente sustituido, cicloalquilo alquilo inferior opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, arilo alquilo inferior opcionalmente sustituido, grupo heterocíclico opcionalmente sustituido, heterocíclicosustituido alquilo inferior s opcionalmente, etc	Es un grupo representado por la fórmula  En donde Z es un alquilenos C₁₋₆ y el anillo D es fenilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyente(s) seleccionado(s) de un átomo de halógeno y -OR^{b1}, en donde R^{b1} es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁₋₆.
 y	B ¹ y B ²	X
son iguales o diferentes y cada uno es (1) un átomo de hidrógeno, (2) un grupo carboxilo, (3) -CO-NR^aR^b, en donde R^a y R^b son iguales o diferentes y cada uno es (i) un átomo de hidrógeno, (ii) un grupo alquilo de C₁₋₆ opcionalmente sustituido con 1 a 5 sustituyentes iguales o diferentes seleccionados del siguiente grupo B, o (iii) un grupo cicloalquilo de C₃₋₈, o R^a y R^b forman opcionalmente, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, un heteroanillo monocíclico saturado que opcionalmente contiene, además de átomos de carbono y un átomo de nitrógeno, 1 a 5 heteroátomos seleccionados de un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre, y opcionalmente sustituido con 1 a 5 sustituyentes iguales o diferentes seleccionados del siguiente grupo B, (4) un grupo alquilo de C₁₋₆ opcionalmente sustituido con 1 a 5 sustituyentes iguales o diferentes seleccionados del siguiente grupo A, o (5) un grupo ciano, o R² y R³, o R⁴ y R⁵ forman opcionalmente, junto con el átomo de carbono al que están unidos, i) cicloalcano de C₃₋₈, o ii) un heteroanillo monocíclico saturado que contiene, además de átomos de carbono, 1 a 6 heteroátomos seleccionados de un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre, en donde R², R³, R⁴ y R⁵ no son átomos de hidrógeno al mismo tiempo, R⁶ es (1) un grupo alquilo de C₁₋₆	es CR²⁰R²¹ donde R²⁰ y R²¹ son independientemente hidrógeno, alquilo inferior opcionalmente sustituido, cicloalquilo opcionalmente sustituido, cicloalquilo alquilo inferior opcionalmente sustituido	Es (1) -C(R^{x1})(R^{x2})-C(R^{x3})(R^{x4})-# o (2) -C(R)=C(R^{x8})-#, en donde # muestra el lado para ser unido a Y1 del anillo B, R^{x1} a R^{x4}, R^{x7} y R^{x5} cada uno se selecciona independientemente del siguiente grupo C, R^{x1} y R^{x2}, y R^{x3} y R^{x4} cada uno independientemente forman opcionalmente un cicloalquilo C₃₋₈ junto con el átomo de carbono adyacente;

opcionalmente sustituido con los 1 a 5 átomos de halógeno iguales o diferentes, (2) un grupo alcoxi de C₁₋₆, (3) un átomo de halógeno, o (4) un grupo cicloalquilo de C₃₋₈, Y es (1) CH, o (2) un átomo de nitrógeno, m es un número entero de 1 a 5 y cuando m es un número entero de 2 a 5, entonces cada R⁶ puede ser igual o diferente, y n es un número entero de 1 a 3, grupo A: (a) -CO-NR^{A1}R^{A2}		
	No refiere	R^{y2} en donde R^{y2} es grupo heterocíclico opcional sustituido, -CO₂R^{c1}-CON₂R^{c2} R^{c3} RCO^{c4} entre otros (Pág. 12 , Párr [19] a [23])
Realizaciones preferidas	Ejemplos	Ejemplos
 (Fl. 457, compuesto 1)  (Fl. 472, compuesto 3)  (Fl. 574, compuesto 222)  (Fl. 584, estructura 258)	 (Pág. 23, ej. B-1)  (Pág. 35, ej. B-7)	 (Pág. 131, ej. 300)  (Pág. 121, ej. 161)  (Pág. 127, ej. 248)  (Pág. 122, ej. 180)  (Pág. 131, ej. 309)  (Pág. 136, ej. 378)  (Pág. 137, ej. 380)

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga derivados 9-hidroxi-1,8-dioxo-1,3,4,8-tetrahydro-2H-pirido[1,2-a]pirazin-7-carboxamida inhibidores de la integrasa del VIH.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto de fórmula (I) divulgado en el documento D1 consiste en que la solicitud define que el

sustituyente en la posición 7 del anillo 2*H*-pirido[*l*,2-*a*]pirazin es un grupo aril-(tiazol o tiadiazol) mientras que el documento D1 divulga un sustituyente bencilamida.

El efecto que logra al remplazar el grupo bencilamida en la posición 7 de 2*H*-pirido[*l*,2-*a*]pirazin por el sustituyente aril-(tiazol o tiadiazol) es obtener nuevos compuestos alternativos inhibidores de la integrasa del VIH.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: cómo obtener nuevos compuestos alternativos inhibidores de la integrasa del VIH.

Sin embargo, el documento D2 divulga inhibidores de la integrasa del VIH que presentan en la posición 7 del anillo 2*H*-pirido[*l*,2-*a*]pirazin grupos como tiazol, tiadiazol y bencilamida opcionalmente sustituidos.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, estaría motivada a reemplazar el grupo carboxamida por un grupo tiazol o tiadiazol en los compuestos divulgados en el documento D1 de la manera que lo sugiere el documento D2 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2-30, 32-34, 40 y 41 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

9. Conclusión

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

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	US2009/0143356	1-30, 32-34, 40 y 41	Nivel inventivo
D2	ES2315700	1-30, 32-34, 40 y 41	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 2013-12-24

Elaboró: Lenin Roberto Guerrero
Revisó: Consuelo Leguizamon Leguizamon
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez