

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

2020
Bogotá, D.C.,

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-039097- -00003-0000

Fecha: 2010-09-30 12:18:12 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 519 TRASLADOINFORME Folios: 1

Abogado:

ALICIA LLOREDA RICAURTE

ASUNTO:	Radicación No.	07 039 097
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio	
	Folios	1 284 1

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:

Documentos estudiados:

Descripción:	Folios 72 a 206 como se radicó inicialmente.
Reivindicaciones:	Folios 268 a 284 como se radico 25.16.2007.
Prioridad:	60/618.174 2004-10-13 US

Objeto de la Invención

Titulo de la invención: "Pirazolobenzodiazepinas disustituidas útiles como inhibidores de CDK2 y angiogénesis, y para el tratamiento de cáncer de seno, colon, pulmón y próstata"

Problema Técnico Planteado: "Necesidad de compuestos capaces de inhibir la quinasa CDK2"

Solución: "Proveer compuestos derivados de pirazolobenzodiazepinas disustituidas de acuerdo a la formula I"

IPC: A61K 031/551, A61P 035/000, C07D 487/004

Reivindicación 1 - 51: Compuestos de formula IV
Reivindicación 52: Composición que contienen al compuesto de formula IV
Reivindicación 53 - 55: proceso para obtener el compuesto reclamado
Reivindicación 56 - 58: Compuestos XIV
Reivindicación 59 - 61: Compuesto de acuerdo a la fórmula IV
Reivindicación 62: Composición

Análisis de la Solicitud de Patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

Concisión, Claridad y Soporte en la descripción: Las reivindicaciones 1 a 52 se refieren al compuesto de acuerdo a la formula IV. Al respecto la reivindicación 1 define los radicales de manera muy amplia, p.ej. R1 es definido como alquilo, alcoxi, halógeno, COOH, COO-alquilo y R2 es definido como alquilo, halógeno, alquilo, (f.268, Rv. 1, ln. 5-22), como se observa no se han definido el numero de carbonos, ni los halógenos específicos, ni las funciones específicas. Esto conduce a que la materia protegida sea bastante amplia, ya que el número de posibles permutaciones es altísima, y de esta manera se puede observar que la descripción no soporta todos estos compuestos reclamados, y probablemente no todos poseen la misma actividad biológica. De hecho, se observa que la descripción muestra el dato de IC₅₀ para CDK2 para compuestos donde R1 es F o CH, R₂, OCH₃, OCH₂CH₂OCH₃, OCH(CH₃)₂, R₃, CH₃, R₄, Cl (f.192, tabla I).

Se requiere al solicitante que restrinja la materia reclamada en la reivindicación principal con el fin de darle concisión y que encuentre soporte en la descripción a la materia que se desea proteger.

Determinación del Estado de la Técnica

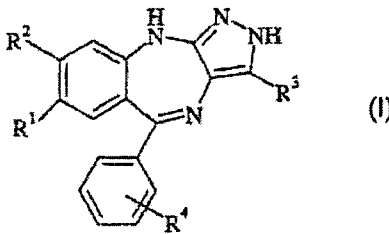
El Estado de la Técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de patente 2004-10-13 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO0064900	Pyrazolobenzodiazepines as CDK2 inhibitors	02.11.2000

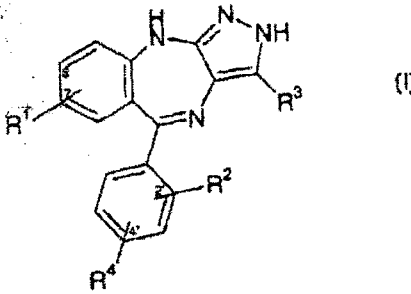
Análisis de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 dice: "La reivindicación 1 dice: "Un compuesto de la formula IV en R la que R1 es alquilo, alcoxi, halógeno, COOH (...)" (ver folio 268-269)



D1 muestra pirazolobenzodiazepinas como inhibidores CDK2 de acuerdo a la formula I (derecha), capaces de inhibir cinasas dependientes de ciclina, en particular CDK2 (portada, p.2, 7). D1 enseña que los compuestos pueden ser usados en el tratamiento de enfermedades relacionadas con la proliferación celular como el cáncer, especialmente de mama, próstata, colon y pulmón. (p.1, ln. 1-15, ln.28; p.4, ln.5-11). Revela que R1 es -CN, OR₅, halógeno, -COOR₇, -CONR₈R₉; R₄, halógeno, -NO₂, -CF₃,



alquilo; R₂, hidrogeno; R₃, alquilo (p.2, ln.15-25; p.3, ln. 1-5). Adicionalmente, D1 enseña que R1 puede estar en posición 8 o 7(p.7, ln. 10-15), también presenta la síntesis de compuestos de acuerdo a la formula I (p.10-14), así como composiciones que los contuvieran (p. 15-16) y presenta ensayos de actividad antiproliferativa, especialmente actividad inhibitoria de CDK (p.39, 40) los cuales muestran un grupo compuestos que se logran un IC₅₀ que va del 0.01 - 0.99 µM (p.41, tabla IA).

La solicitud se diferencia de D1 en el radical R2 de la formula IV.

El Efecto Técnico Logrado por la diferencia es obtener una respuesta de inhibición de CDK₂ - IC₅₀ entre un rango de 1.330 a 0.184 µM (f.192, tabla I).

El Problema Técnico Objetivo de esta solicitud es la necesidad de compuestos alternativos capaces de inhibir CDK2 para tratar enfermedades proliferativas como el cáncer, especialmente de pulmón, mama, próstata y colon.

La persona versada al enfrentarse al problema planteado - que era buscar compuestos capaces de inhibir la actividad de CDK 2 para tratar cáncer de mama, próstata, colon y pulmón - habría buscado en una anterioridad que se relacionara con el mismo campo, como es el caso de D1, en donde se sugieren derivados de pirazolobenzodiazepinas, de acuerdo con lo mencionado anteriormente en donde las posiciones 7 y 8 pueden ser ocupadas por el radical R1. Esto sugeriría al experto que la posición 7 y 8 podría estar sustituida simultáneamente como se presenta en la presente solicitud por lo radicales R1 y R2.

Por otro lado, la anterioridad muestra un grupo numeroso de compuestos que poseen un IC₅₀ de CDK2 dentro del rango de 0.01-0.99 µM, mientras que al observar la tabla I de la presente solicitud se observa que el rango para un grupo de solo 4 compuestos esta dentro de 1.330-0.184 µM. Esto muestra que la presente solicitud presenta compuestos que necesitan una mayor dosificación para obtener el efecto inhibitor en dicho ensayos.

Lo anterior permite concluir que el resultado obtenido por D1 era mejor que el mostrado por la presente solicitud. Se concluye entonces que la materia descrita en la presente reivindicación 1 carece de nivel inventivo.

Las demás reivindicaciones no añaden características que le confieran nivel inventivo a la solicitud.

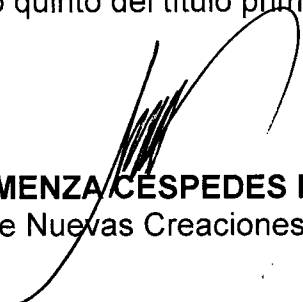
Conclusión

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

	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D4	WO0064900	1-62	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 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 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
10 OCT 2010

CONCEPTO TECNICO NUMERO: 2810	EXAMINADOR TÉCNICO Código:202092
----------------------------------	-------------------------------------