

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

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
EMILIO FERRERO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-039732- -00004-0000

Fecha: 2010-12-02 14:41:18 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 519 TRASLADOINFORME Folios: 1

ASUNTO	Radicación	07-39732
	Trámite	011
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio	215860
	Folios	008

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

No. Sol. Internacional	<u>PCT/GB2005/003621</u>
Fecha de Presentación Internacional	<u>20/09/2005</u>

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

Descripción: Folios 74 a 148 como se radicó inicialmente.

Reivindicaciones: Folios 149 a 151 como se radicó inicialmente.

Prioridad: Folio 1 US 60/611,515 del 20/09/2004.

2. Objeto de la invención

Título: INHIBIDORES DE ADN-PK.

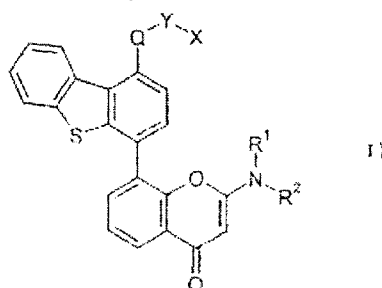
Objeto: La invención consiste en compuestos derivados de 2-morfolin-4-oxo-4H cromano de fórmula general (I) como inhibidores de la interacción de proteínas quinasas del ADN (ADN-PK) así como sus composiciones farmacéuticas.

El problema planteado en la solicitud es proveer nuevos compuestos inhibidores ADN-PK con mejores propiedades a los ya conocidos.

Para solucionar este problema técnico la solicitud proporciona compuestos derivados de 2-morfolin-4-oxo-4H cromano de fórmula general (I) y sus composiciones farmacéuticas.

EXP 2007 039732

Reivindicaciones 1 a 10 y 12: Compuesto de fórmula (I)



Reivindicación 11: Una composición farmacéuticas que comprenden un compuesto de acuerdo a la reivindicación 1 junto con vehículos aceptables.

Reivindicaciones 13 a 15: Uso de los compuestos de fórmula (I).

Se catalogó la invención según la IPC así: C07D 409/14 y A61K 31/551.

3. De la solicitud de Patente

Título: El título esta redactado de una manera muy amplia. Se recomienda modificarlo de forma tal que indique la estructura de los compuestos de la invención.

Descripción (artículo 28 D 486)

Los sustituyentes X, R¹ y R² de la fórmula (I) generan una gran diversidad y cantidad de compuestos que no corresponden a la invención ya que de acuerdo a los esquemas e intermedios de síntesis indicados en la descripción (folios 122 a 130) no es posible obtener tal cantidad de compuestos.

Así, por ejemplo, al verificar los compuestos que se pueden obtener mediante los esquemas e intermedios de síntesis descritos, solo están los compuestos donde R¹ y R² forman un grupo morfolino.

De igual forma la descripción no indica la obtención de solvatos y profármacos de los compuestos de la invención.

Por lo anterior, es evidente que la descripción no contiene la información suficiente para que una persona versada en la materia obtenga tal diversidad de compuestos como los que resultan de los sustituyentes R¹ y R² de la fórmula (I).

Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

En el capítulo reivindicatorio se encuentran expresiones que no son concisas como *"formas químicamente protegidas"*, *"anillo heterocíclico opcionalmente sustituido que tiene de 4 a 8 átomos en el anillo"*, *"arilo de C₅₋₂₀ opcionalmente sustituido"*.

Los sustituyentes X, R¹ y R² de la fórmula (I) de la reivindicación 1 generan un gran número de compuestos que no corresponden a la invención de acuerdo a lo sustentado en la descripción. Se sugiere limitar los compuestos reclamados en la reivindicación 1 a aquellos que se puedan sintetizar de acuerdo a los procedimientos e intermedios descritos y demuestren tener la actividad biológica allí indicada.

La reivindicación 12 caracteriza los compuestos por su uso, lo cual no les otorga ninguna característica adicional.

4. Reivindicaciones relativas a uso o a uso distinto (artículos 14 y 21 D 486)

Las reivindicaciones 13 a 15 indican el uso de los compuestos de fórmula (I), lo cual no se considera como invención y por lo tanto no es patentable.

5. Determinación del Estado de la Técnica

Considerando que la fecha de presentación de la primera solicitud de patente de la cual se reivindica prioridad es 20/09/2004, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

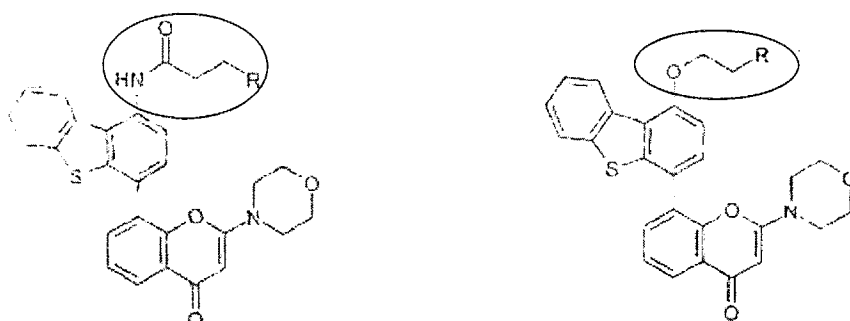
Nº	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	WO 03/024949	DNA-PK INHIBITORS	27/03/2003

6. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D 486)

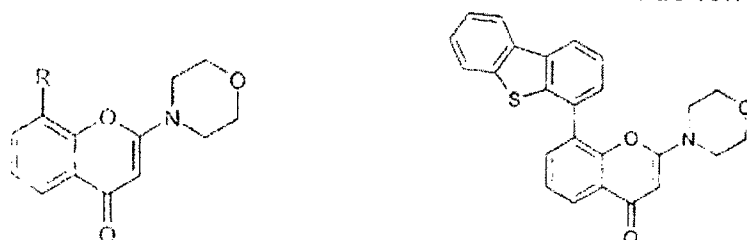
Se procedió a evaluar los requisitos de novedad, nivel inventivo y aplicación industrial para establecer la patentabilidad de la invención reivindicada en la solicitud

Nivel Inventivo: (artículo 18 D 486)

La reivindicación 1 de la solicitud reclama compuestos derivados de 2-morfolin-4-oxo-4H cromano de fórmula (I) como inhibidores ADN-PK



El documento D1 describe inhibidores ADN-PK de fórmula:



(Ejemplo 413 Cl_{50} = 10 nM)

La única diferencia entre los compuestos de la solicitud y los divulgados en D1 es el sustituyente R del dibenzotiofeno. El efecto dado por esta diferencia es un aumento en la potencia como inhibidores ADN-PK con valores de Cl_{50} entre 5 y 95 nM.

El documento D1 también enseña que la actividad inhibidora ADN-PK de los compuestos allí mencionados está dada en gran medida por la presencia del sustituyente 2-morfolino en el núcleo de 4-oxo-4H cromano y plantea la forma y las rutas sintéticas para obtener derivados sustituidos en la posición 8 de dicho núcleo, entre ellos el anillo dibenzotiofeno (ejemplo 413), manteniendo la actividad inhibitoria con Cl_{50} de 10 nM.

Así las cosas, es evidente que la elevada actividad inhibitoria ($CI_{50} < 100 \text{ nM}$) de los compuestos 2-morfolin--8-dibenzotiofen-4-oxo-4H-cromano sustituidos reclamados en la solicitud, ya estaba enseñada por D1.

Dado que D1 divulgaba compuestos derivados de 4-oxo-4H cromano y sus procesos de síntesis, con las mismas características estructurales y propiedades farmacológicas, el técnico medio enfrentado al problema de encontrar compuestos derivados de 4-oxo-4H cromano potentes inhibidores ADN-PK, encuentra en D1 los procesos de síntesis para obtenerlos y buscaría como práctica rutinaria, modificar los sustituyentes de dicho núcleo principal, entre ellos el de la posición 8, como lo indican los esquemas de síntesis de D1, para obtener así compuestos alternativos que no ostentan ningún efecto técnico sorprendente o inesperado (ver datos de CI_{50} tabla 1 de D1 vs folio 147 de la solicitud), por lo tanto los compuestos de la solicitud son resultado de una derivación evidente de las enseñanzas de D1, razón por la cual carecen de altura inventiva.

7. Conclusión

Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

N°	Documento	Reivindicaciones Afectadas	Requisito que Afecta
D1	WO 03/024949	1 a 12	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 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 12 de DIC. 2019

CONCEPTO TECNICO No. 3188	EXAMINADOR TECNICO Código No. 202077
---------------------------	---